

PATENT COOPERATION TREATY

PCT

NOTIFICATION OF ELECTION

(PCT Rule 61.2)

From the INTERNATIONAL BUREAU

To:

Assistant Commissioner for Patents
United States Patent and Trademark
Office
Box PCT
Washington, D.C. 20231
ETATS-UNIS D'AMERIQUE

in its capacity as elected Office

Date of mailing (day/month/year)
28 July 2000 (28.07.00)

International application No.
PCT/EP99/10241

Applicant's or agent's file reference
6713Ltk98

International filing date (day/month/year)
21 December 1999 (21.12.99)

Priority date (day/month/year)
22 December 1998 (22.12.98)

Applicant

SCHREIBER, Jörg et al

1. The designated Office is hereby notified of its election made:

☒ in the demand filed with the International Preliminary Examining Authority on:
23 June 2000 (23.06.00)

☐ in a notice effecting later election filed with the International Bureau on:

2. The election ☒ was

☐ was not

made before the expiration of 19 months from the priority date or, where Rule 32 applies, within the time limit under Rule 32.2(b).

The International Bureau of WIPO
34, chemin des Colombettes
1211 Geneva 20, Switzerland

Facsimile No.: (41-22) 740.14.35

Authorized officer

F. Baechler

Telephone No.: (41-22) 338.83.38

PCT
 WELTORGANISATION FÜR GEISTIGES EIGENTUM
 Internationales Büro
 INTERNATIONALE ANMELDUNG VERÖFFENTLICHT NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE
 INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT)

(51) Internationale Patentklassifikation ⁷ : A61K 7/50, 9/107	A1	(11) Internationale Veröffentlichungsnummer: WO 00/37042 (43) Internationales Veröffentlichungsdatum: 29. Juni 2000 (29.06.00)
(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP99/10241 (22) Internationales Anmeldedatum: 21. Dezember 1999 (21.12.99) (30) Prioritätsdaten: 198 59 427.5 22. Dezember 1998 (22.12.98) DE (71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten ausser US): BEIERSDORF AG (DE/DE); Unnastrasse 48, D-20245 Hamburg (DE). (72) Erfinder; und (73) Erfinder/Anmelder (nur für US): SCHREIBER, Jörg (DE/DE); Erlenkamp 20, D-22087 Hamburg (DE). WOLF, Florian (DE/DE); Husumer Strasse 2, D-20251 Hamburg (DE). CROIZET, Delphine (FR/FR); 9, rue de Bel Air, F-16200 Jarnac (FR). (74) Gemeinsamer Vertreter: BEIERSDORF AG; Unnastrasse 48, D-20245 Hamburg (DE).	(81) Bestimmungsstaaten: JP, US, europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE). Veröffentlicht <i>Mit internationalem Recherchenbericht.</i> <i>Vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche zugelassenen Frist; Veröffentlichung wird wiederholt falls Änderungen eintreffen.</i>	

(54) Title: **COSMETIC OR PHARMACEUTICAL GELS WHICH CONTAIN LECITHIN, OR LOW VISCOSITY O/W MICROEMULSIONS WHICH CONTAIN LECITHIN**

(54) Bezeichnung: **KOSMETISCHE ODER PHARMAZEUTISCHE LECITHINHALTIGE GELE ODER NIEDRIGVISKOSE, LECITHINHALTIGE O/W-MIKROEMULSIONEN**

(57) Abstract

The invention relates to gels or low viscosity transparent or translucent oil-in-water microemulsions which comprise a water phase and an oil phase and which essentially consist of constituents that are not easily volatilized. These constituents contain at least one phospholipid and at least one oil-in-water emulsifier and optionally contain at least one W/O emulsifier which can be obtained by adding the water phase with the constituents thereof to the oil phase with its constituents, especially with the phospholipid and the O/W emulsifier and optionally with the W/O emulsifier, whereby the phases are mixed together and a gel state is attained. If a low viscosity O/W microemulsion is desired, additional parts of the water phase are added and the phases are mixed, whereby the phases can optionally contain additional auxiliary, addition and/or active agents.

(57) Zusammenfassung

Gegenstand der Erfindung sind Gele oder niedrigviskose transparente oder transluzente Mikroemulsionen vom Typ Öl-in-Wasser, umfassend eine Wasserphase und eine Ölphase, welche im wesentlichen aus schwerflüchtigen Bestandteilen zusammengesetzt sind, enthaltend: Mindestens ein Phospholipid und mindestens einen Öl-in-Wasser Emulgator und gegebenenfalls mindestens einen W/O-Emulgator, erhältlich auf die Weise, daß die Wasserphase mit ihren Bestandteilen zu der Ölphase mit ihren Bestandteilen, insbesondere dem Phospholipid und dem O/W-Emulgator und gegebenenfalls dem W/O-Emulgator gegeben wird, wobei die Phasen miteinander vermischt werden und ein Gelzustand erhalten wird, und wenn eine niedrigviskose O/W-Mikroemulsion gewünscht wird, weitere Teile der Wasserphase zugegeben werden und die Phasen vermischt werden, wobei die Phasen gewünschtenfalls weitere Hilfs-, Zusatz- und/oder Wirkstoffe enthalten können.

LEDIGLICH ZUR INFORMATION

Codes zur Identifizierung von PCT-Vertragsstaaten auf den Kopfbögen der Schriften, die internationale Anmeldungen gemäss dem PCT veröffentlichen.

AL	Albanien	ES	Spanien	LS	Lesotho	SI	Slowenien
AM	Armenien	FI	Finnland	LT	Litauen	SK	Slowakei
AT	Österreich	FR	Frankreich	LU	Luxemburg	SN	Senegal
AU	Australien	GA	Gabon	LV	Lettland	SZ	Swasiland
AZ	Aserbaidschan	GB	Vereinigtes Königreich	MC	Monaco	TD	Tschad
BA	Bosnien-Herzegowina	GE	Georgien	MD	Republik Moldau	TC	Togo
BB	Barbados	GH	Ghana	MG	Madagaskar	TJ	Tadschikistan
BE	Belgien	GN	Guinea	MK	Die ehemalige jugoslawische Republik Mazedonien	TM	Turkmenistan
BF	Burkina Faso	GR	Griechenland	ML	Mali	TR	Türkei
BG	Bulgarien	HU	Ungarn	MN	Mongolei	TT	Trinidad und Tobago
BJ	Benin	IE	Irland	MR	Mauretanien	UA	Ukraine
BR	Brasilien	IL	Israel	MW	Malawi	UG	Uganda
BY	Belarus	IS	Island	MX	Mexiko	US	Vereinigte Staaten von Amerika
CA	Kanada	IT	Italien	NE	Niger	UZ	Usbekistan
CP	Zentralafrikanische Republik	JP	Japan	NL	Niederlande	VN	Vietnam
CG	Kongo	KE	Kenia	NO	Norwegen	YU	Jugoslawien
CH	Schweiz	KG	Kirgisistan	NZ	Neuseeland	ZW	Zimbabwe
CI	Côte d'Ivoire	KP	Demokratische Volksrepublik Korea	PL	Polen		
CM	Kamerun	KR	Republik Korea	PT	Portugal		
CN	China	KZ	Kasachstan	RO	Rumänien		
CU	Kuba	LC	St. Lucia	RU	Russische Föderation		
CZ	Tschechische Republik	LJ	Liechtenstein	SD	Sudan		
DE	Deutschland	LK	Sri Lanka	SE	Schweden		
DK	Dänemark	LR	Liberia	SG	Singapur		
RE	Estland						

WO 00/37042

PCT/EP99/10241

Beschreibung

Kosmetische oder pharmazeutische lecithinhaltige Gele oder niedrigviskose, lecithinhaltige O/W-Mikroemulsionen

Die vorliegende Erfindung betrifft Phospholipide enthaltende Gele oder Mikroemulsionen vom Typ Öl-in-Wasser, Verfahren zu ihrer Herstellung sowie ihre Verwendung für kosmetische oder pharmazeutische Zwecke. Sie werden insbesondere topisch angewendet.

Unter kosmetischer Hautpflege ist in erster Linie zu verstehen, daß die natürliche Funktion der Haut als Barriere gegen Umwelteinflüsse (z.B. Schmutz, Chemikalien, Mikroorganismen) und gegen den Verlust von körpereigenen Stoffen (z.B. Wasser, natürliche Fette, Elektrolyte) gestärkt oder wiederhergestellt wird.

Wird diese Funktion gestört, kann es zu verstärkter Resorption toxischer oder allergener Stoffe oder zum Befall von Mikroorganismen und als Folge zu toxischen oder allergischen Hautreaktionen kommen.

Ziel der Hautpflege ist es ferner, den durch tägliche Waschen verursachten Fett- und Wasserverlust der Haut auszugleichen. Dies ist gerade dann wichtig, wenn das natürliche Regenerationsvermögen nicht ausreicht. Außerdem sollen Hautpflegeprodukte vor Umwelteinflüssen, insbesondere vor Sonne und Wind, schützen und die Hautalterung verzögern.

Medizinische Zusammensetzungen enthalten in der Regel ein oder mehrere Medikamente in wirksamer Konzentration. Der Einfachheit halber wird zur sauberen Unterscheidung zwischen kosmetischer und medizinischer Anwendung und entsprechenden Produkten auf die gesetzlichen Bestimmungen der Bundesrepublik Deutschland verwiesen (z.B. Kosmetikverordnung, Lebensmittel- und Arzneimittelgesetz).

WO 00/37042

PCT/EP99/10241

2

Häufige Erscheinungsformen kosmetischer oder dermatologischer Zubereitungen sind feindisperse Mehrphasensysteme, in welchen eine oder mehrere Fett- bzw. Ölphasen neben einer bzw. mehreren Wasserphasen vorliegen. Von diesen Systemen sind wiederum die eigentlichen Emulsionen die am weitesten verbreiteten.

In einfachen Emulsionen liegen in der einen Phase feindisperse, von einer Emulgatorhülle umschlossene Tröpfchen der zweiten Phase (Wassertröpfchen in W/O- oder Lipidvesikel in O/W-Emulsionen) vor. Die Tröpfchendurchmesser der gewöhnlichen Emulsionen liegen im Bereich von ca. 1 μm bis ca. 50 μm . Solche „Makroemulsionen“, sind, ohne weitere färbende Zusätze, milchigweißgefärbt und opak. Feinere „Makroemulsionen“, deren Tröpfchendurchmesser im Bereich von ca. 10^{-1} μm bis ca. 1 μm liegen, sind, wiederum ohne färbende Zusätze, bläulichweißgefärbt und undurchsichtig.

Mizellaren und molekularen Lösungen mit Partikeldurchmessern kleiner als ca. 10^{-2} μm , ist vorbehalten, klar und transparent zu erscheinen.

Der Tröpfchendurchmesser von transparenten bzw. transluzenten Mikroemulsionen dagegen liegt im Bereich von etwa 10^{-2} μm bis etwa 10^{-1} μm . Solche Mikroemulsionen sind meist niedrigviskos. Die Viskosität vieler Mikroemulsionen vom O/W-Typ ist vergleichbar mit der des Wassers.

Vorteil von Mikroemulsionen ist, daß in der dispersen Phase Wirkstoffe feiner dispers vorliegen können als in der dispersen Phase von „Makroemulsionen“. Ein weiterer Vorteil ist, daß sie aufgrund ihrer niedrigen Viskosität versprühbar sind. Werden Mikroemulsionen als Kosmetika verwendet, zeichnen sich entsprechende Produkte durch hohe kosmetische Eleganz aus.

Nachteilig an den Mikroemulsionen des Standes der Technik ist, daß stets ein hoher Gehalt an einem oder mehreren Emulgatoren eingesetzt werden muß, da die geringe Tröpfchengröße eine hohe Grenzfläche zwischen den Phasen bedingt, welche in der Regel durch Emulgatoren stabilisiert werden muß.

An sich ist die Verwendung der üblichen kosmetischen Emulgatoren unbedenklich. Dennoch können Emulgatoren, wie letztlich jede chemische Substanz, im Einzelfalle allergische oder auf Überempfindlichkeit des Anwenders beruhende Reaktionen hervorrufen.

WO 00/37042

PCT/EP99/10241

3

So ist bekannt, daß bestimmte Lichtdermatosen durch gewisse Emulgatoren, aber auch durch verschiedene Fette, und gleichzeitige Exposition von Sonnenlicht ausgelöst werden. Solche Lichtdermatosen werden auch „Mallorca-Akne“ genannt. Eine Aufgabe der vorliegenden Erfindung war daher, Sonnenschutzprodukte zu entwickeln.

So betrifft die vorliegende Erfindung als besondere Ausführungsformen kosmetische und dermatologische Lichtschutzzubereitungen, insbesondere hautpflegende kosmetische und dermatologische Lichtschutzzubereitungen.

Die schädigende Wirkung des ultravioletten Teils der Sonnenstrahlung auf die Haut ist allgemein bekannt. Während Strahlen mit einer Wellenlänge, die kleiner als 290 nm ist (der sogenannte UVC-Bereich), von der Ozonschicht in der Erdatmosphäre absorbiert werden, verursachen Strahlen im Bereich zwischen 290 nm und 320 nm, dem sogenannten UVB-Bereich, ein Erythem, einen einfachen Sonnenbrand oder sogar mehr oder weniger starke Verbrennungen.

Als ein Maximum der Erythemwirksamkeit des Sonnenlichtes wird der engere Bereich um 308 nm angegeben.

Zum Schutze gegen UVB-Strahlung sind zahlreiche Verbindungen bekannt, bei denen es sich zumeist um Derivate des 3-Benzylidencamphers, der 4-Aminobenzoësäure, der Zimtsäure, der Salicylsäure, des Benzophenons sowie auch des 2-Phenylbenzimidazols handelt.

Auch für den Bereich zwischen etwa 320 nm und etwa 400 nm, den sogenannten UVA-Bereich, ist es wichtig, Filtersubstanzen zur Verfügung zu haben, da auch dessen Strahlen Schäden hervorrufen können. So ist erwiesen, daß UVA-Strahlung zu einer Schädigung der elastischen und kollagenen Fasern des Bindegewebes führt, was die Haut vorzeitig altern läßt, und daß sie als Ursache zahlreicher phototoxischer und photoallergischer Reaktionen zu sehen ist. Der schädigende Einfluß der UVB-Strahlung kann durch UVA-Strahlung verstärkt werden.

Die UV-Strahlung kann aber auch zu photochemischen Reaktionen führen, wobei dann die photochemischen Reaktionsprodukte in den Hautmetabolismus eingreifen.

WO 00/37042

PCT/EP99/10241

4

Um diesen Reaktionen vorzubeugen, können den kosmetischen bzw. dermatologischen Formulierungen zusätzlich Antioxidantien und/oder Radikalfänger einverleibt werden.

UV-Absorber bzw. UV-Reflektoren sind die meisten anorganischen Pigmente, die bekannterweise in der Kosmetik zum Schutze der Haut vor UV-Strahlen verwendet werden. Dabei handelt es sich um Oxide des Titans, Zinks, Eisens, Zirkoniums, Siliciums, Mangans, Aluminiums, Cers und Mischungen davon, sowie Abwandlungen.

Wegen ihrer guten Versprühbarkeit eignen sich Mikroemulsionen auch für andere kosmetische dermatologische Anwendungen, beispielsweise Desodorantien, so daß die vorliegende Erfindung in einer besonderen Ausführungsform Mikroemulsionen als Grundlage für kosmetische Desodorantien betrifft.

Kosmetische Desodorantien dienen dazu, Körpergeruch zu beseitigen, der entsteht, wenn der an sich geruchlose frische Schweiß durch Mikroorganismen zersetzt wird. Den üblichen kosmetischen Desodorantien liegen unterschiedliche Wirkprinzipien zugrunde.

In sogenannten Antitranspirantien kann durch Adstringentien - vorwiegend Aluminiumsalze wie Aluminiumhydroxychlorid (Aluchlorhydrat) - die Bildung des Schweißes reduziert werden.

Durch die Verwendung antimikrobieller Stoffe in kosmetischen Desodorantien kann die Bakterienflora auf der Haut reduziert werden. Dabei sollten im Idealfalle nur die Geruch verursachenden Mikroorganismen wirksam reduziert werden. Der Schweißfluß selbst wird dadurch nicht beeinflusst, im Idealfalle wird nur die mikrobielle Zersetzung des Schweißes zeitweilig gestoppt.

Auch die Kombination von Adstringentien mit antimikrobiell wirksamen Stoffen in ein und derselben Zusammensetzung ist gebräuchlich.

Desodorantien sollen folgende Bedingungen erfüllen:

- 1) Sie sollen eine zuverlässige Desodorierung bewirken.
- 2) Die natürlichen biologischen Vorgänge der Haut dürfen nicht durch die Desodorantien beeinträchtigt werden.

WO 00/37042

PCT/EP99/10241

3

- 3) Die Desodorantien müssen bei Überdosierung oder sonstiger nicht bestimmungsgemäßer Anwendung unschädlich sein.
- 4) Sie sollen sich nach wiederholter Anwendung nicht auf der Haut anreichern.
- 5) Sie sollen sich gut in übliche kosmetische Formulierungen einarbeiten lassen.

Bekannt und gebräuchlich sind sowohl flüssige Desodorantien, beispielsweise Aerosolsprays, Roll-ons und dergleichen als auch feste Zubereitungen, beispielsweise Deo-Stifte ("Sticks"), Puder, Pudersprays, Intimreinigungsmittel usw.

Auch die Verwendung von Mikroemulsionen als Grundlage für desodorierende oder antitranspirant wirkende Zubereitungen sind bekannt. Deren relativ hoher Gehalt an Emulgatoren, mit den geschilderten Nachteilen, war bisher ein Übelstand, dem es abzuheilen galt.

Eine weitere Aufgabe der vorliegenden Erfindung war es also, Zubereitungen zu entwickeln, welche als Grundlage für kosmetische Desodorantien bzw. Antitranspirantien geeignet sind, und die Nachteile des Standes der Technik nicht aufweisen.

Weiterhin war es eine Aufgabe der Erfindung, kosmetische Grundlagen für kosmetische Desodorantien zu entwickeln, die sich durch gute Hautverträglichkeit auszeichnen.

Ferner war eine Aufgabe der vorliegenden Erfindung, Produkte auf der Basis von Mikroemulsionen mit einer möglichst breiten Anwendungsvielfalt zur Verfügung zu stellen. Beispielsweise sollten Grundlagen für Zubereitungsformen wie Reinigungsemulsionen, Gesichts- und Körperpflegezubereitungen, aber auch ausgesprochen medizinisch-pharmazeutische Darreichungsformen geschaffen werden, zum Beispiel Zubereitungen gegen Akne und andere Hauterscheinungen.

In einer besonderen Ausführungsform betrifft die Erfindung daher Reinigungsemulsionen, insbesondere Gesichtsreinigungsemulsionen, bevorzugt Make-up-Entferner, beispielsweise Augenmake-up-Entferner.

Solche Zubereitungen sind an sich bekannt. Üblicherweise handelt es sich dabei um Abmischungen kosmetischer Öle oder wäßrige Zubereitungen oberflächenaktiver Substanzen, deren Funktion darin besteht, die Verunreinigung oder den Make-up-Körper zu solubilisieren und von der Haut zu entfernen.

WO 00/37042

PCT/EP99/10241

6

Wasserfestes Augen-Make-up, beispielsweise Mascara, ist mit Make-up-Entfernern auf wäßriger Basis nur mit speziellen Tensiden zufriedenstellend zu entfernen. Diese Tenside besitzen aber oft eine nur begrenzte physiologische Verträglichkeit. Bei einem Kontakt solcher Stoffe mit der Schleimhaut, insbesondere der Augenschleimhaut, führen diese Stoffe zu Reizungen, die sich beispielsweise in einer Rötung der Augen äußern. Reaktionen dieser Art sind typisch für tensidhaltige Produkte.

Eine Aufgabe der vorliegenden Erfindung war mithin, solchen Problemen Abhilfe zu schaffen.

Die vorliegende Erfindung betrifft in einer weiteren Ausführungsform haarkosmetische Zubereitungen. Insbesondere betrifft die vorliegende Erfindung haarkosmetische Zubereitungen zur Pflege des Haars und der Kopfhaut. In einer bevorzugten Ausführungsform betrifft die vorliegende Erfindung Zubereitungen, die dazu dienen, das einzelne Haar zu kräftigen und/oder der Haartracht insgesamt Halt und Fülle zu verleihen.

Das menschliche Haar kann, grob verallgemeinert, unterteilt werden in den lebenden Teil, die Haarwurzel, und den toten Teil, den Haarschaft. Der Haarschaft seinerseits besteht aus der Medulla, welche allerdings entwicklungsgeschichtlich bedingt für den neuzeitlichen Menschen unbedeutend geworden und zurückgebildet ist und bei dünnem Haar oft gänzlich fehlt, ferner dem die Medulla umschließenden Cortex und der die Gesamtheit aus Medulla und Cortex umhüllenden Cuticula.

Insbesondere die Cuticula, aber auch der keratinöse Bereich zwischen Cuticula und Cortex als Außenhülle des Haares sind besonderer Beanspruchung durch Umwelteinflüsse, durch Kämmen und Bürsten, aber auch durch Haarbehandlung, insbesondere Haarfärbung und Haarverformung, z.B. Dauerwellverfahren, ausgesetzt.

Bei besonders aggressiver Beanspruchung, beispielsweise der Bleichung mit Oxidantien wie Wasserstoffperoxid, bei welcher die im Cortex verteilten Pigmente oxidativ zerstört werden, kann auch das Innere des Haars in Mitleidenschaft gezogen werden. Soll menschliches Haar dauerhaft gefärbt werden, kommen in der Praxis lediglich oxidierende Haarfärbeverfahren in Betracht. Beim oxidativen Haarfärben erfolgt die Ausbildung des Farbstoffchromophoren durch Reaktion von Präkursoren (Phenole, Aminophenole, seltener auch Diamine) und

WO 00/37042

PCT/EP99/10241

7

Basen (meistens p-Phenylendiamin) mit dem Oxidationsmittel, zumeist Wasserstoffperoxid. Wasserstoffperoxidkonzentrationen um 6% werden dabei gewöhnlich verwendet.

Üblicherweise wird davon ausgegangen, daß neben der Färbewirkung auch eine Bleichwirkung durch das Wasserstoffperoxid erfolgt. In oxidativ gefärbtem menschlichem Haar sind, ähnlich wie bei gebleichtem Haar, mikroskopische Löcher an den Stellen, an denen Melanin-granula vorlagen, nachweisbar. Tatsache ist, daß das Oxidationsmittel Wasserstoffperoxid nicht nur mit den Farbvorstufen, sondern auch mit der Haarsubstanz reagieren und dabei unter Umständen eine Schädigung des Haares bewirken kann.

Auch die Haarwäsche mit aggressiven Tensiden kann das Haar beanspruchen, zumindest dessen Erscheinungsbild oder das Erscheinungsbild der Haartracht insgesamt herabsetzen. Beispielsweise können bestimmte wasserlösliche Haarbestandteile (z.B. Harnstoff, Harnsäure, Xanthin, Keratin, Glycogen, Citronensäure, Milchsäure) durch die Haarwäsche herausgelaut werden.

Aus diesen Gründen werden seit geraumer Zeit teils Haarpflegekosmetika verwendet, welche dazu bestimmt sind, nach Einwirken aus dem Haar wieder ausgespült zu werden, teils solche, welche auf dem Haar verbleiben sollen. Letztere können so formuliert werden, daß sie nicht nur der Pflege des einzelnen Haars dienen, sondern auch das Aussehen der Haartracht insgesamt verbessern, beispielsweise dadurch, daß sie dem Haar mehr Fülle verleihen, die Haartracht über einen längeren Zeitraum fixieren oder seine Frisierbarkeit verbessern.

Durch quaternäre Ammoniumverbindungen beispielsweise läßt sich die Kämmbarkeit der Haare entscheidend verbessern. Solche Verbindungen ziehen auf das Haar auf und sind oft noch nach mehreren Haarwäschen auf dem Haar nachweisbar.

Der Stande der Technik ließ es aber an Wirkstoffen und Zubereitungen mangeln, welche dem geschädigten Haar in befriedigender Weise Pflege zukommen ließen. Auch erwiesen sich Zubereitungen, die der Haartracht Fülle geben sollten, oft als unzureichend, zumindest waren sie ungeeignet, als Haarpflegezubereitungen eingesetzt zu werden. Die Haartracht fixierende Zubereitungen des Standes der Technik enthalten beispielsweise in der Regel viskose Bestandteile, welche Gefahr laufen, ein Gefühl der Klebrigkeit zu erwecken, welches oft durch geschickte Formulierung kompensiert werden muß.

WO 00/37042

PCT/EP99/10241

8

Aufgabe war daher, auch diesen den Nachteilen des Standes der Technik Abhilfe zu schaffen.

Schließlich sollte auch grundsätzlich der Weg zu innerlich anwendbaren Emulsionen, beispielsweise für die parenterale Gabe pharmazeutischer Wirkstoffe sowie zur parenteralen Ernährung durch die vorliegende Erfindung eröffnet werden.

Eine besondere Aufgabe der vorliegenden Erfindung war es, feindisperse Zubereitungen vom Typ Öl-in-Wasser mit einem möglichst niedrigen Emulgatorgehalt zur Verfügung zu stellen, welche nicht die Nachteile des Standes der Technik aufweisen und welche für verschiedenste kosmetische und/oder dermatologische Anwendungen, beispielsweise die vorab beschriebenen Verwendungen finden können. Eine weitere Aufgabe der Erfindung war, das begrenzte Angebot an feindispersen Zubereitungen vom Typ Öl-in-Wasser des Standes der Technik zu bereichern.

Es ist an sich bekannt, daß hydrophile Emulgatoren, namentlich polyethoxylierte und polypropoxylierte Emulgatoren, bei steigender Temperatur ihr Löslichkeitsverhalten von wasserlöslich zu fettlöslich ändern. Ein Kennzeichen für die Hydrophilie eines gegebenen Emulgators ist dessen HLB-Wert.

Die Definition des HLB-Wertes ist für Polyolfettsäureester gegeben durch die Beziehung

$$\text{HLB} = 20 \cdot (1 - S/A) \quad (\text{Formel I})$$

Für eine Gruppe von Emulgatoren, deren hydrophiler Anteil nur aus Ethylenoxideinheiten besteht, gilt die Beziehung

$$\text{HLB} = E/5 \quad (\text{Formel II})$$

wobei

S =	Verseifungszahl des Esters,
A =	Säurezahl der zurückgewonnenen Säure
E =	Massenanteil Ethylenoxid (in %) am Gesamtmolekül

bedeuten.

WO 00/37042

PCT/EP99/10241

9

Emulgatoren mit HLB-Werten von 6-8 sind im allgemeinen W/O-Emulgatoren, solche mit HLB-Werten von 8-18 sind im allgemeinen O/W-Emulgatoren.

Literatur: "Kosmetik - Entwicklung, Herstellung und Anwendung kosmetischer Mittel"; W.Umbach (Hrsg.), Georg Thieme Verlag 1988.

Der Temperaturbereich, in dem die Emulgatoren ihre Löslichkeit ändern, wird Phaseninversionstemperaturbereich genannt. Für den Phaseninversionstemperaturbereich soll innerhalb dieser Schrift auch die Abkürzung „PIT“, gebraucht werden.

Die Änderung dieses Löslichkeitsverhaltens äußert sich bekanntermaßen darin, daß eine Mischung aus Wasser, Öl und O/W-Emulgatoren, welche unterhalb des PIT nach Rühren eine O/W-Emulsion ergibt, auf eine Temperatur oberhalb des PIT gebracht wird, typischerweise etwa 70-90° C, als Zwischenstufe den Zustand einer Mikroemulsion durchlaufen kann, um schließlich oberhalb des PIT eine W/O-Emulsion zu ergeben. Wird diese Emulsion abgekühlt, wird wieder eine O/W-Emulsion erhalten, welche aber eine Tröpfchengröße von bis zu 200 nm besitzt und dabei im Bereich zwischen einer Mikroemulsion und einer feinen Makroemulsion liegt.

Auf solche Weise hergestellte Mikroemulsionen des Standes der Technik haben allerdings den Nachteil, daß erstens die Tröpfchengröße immer noch recht hoch ist, daß die Emulsion bei Raumtemperatur opak weiß bis bläulich ist und/oder immer noch ein hoher Anteil an einem oder mehreren Emulgatoren nötig ist.

Weiterhin ist nachteilig, daß auf solche Weise hergestellte Mikroemulsionen zwar bei hoher Temperatur, also beispielsweise im PIT, praktisch transparent sein können, aber beim Absinken auf Raumtemperatur wieder undurchsichtig werden.

Auch diesen Übelständen galt es also, abzuhelpfen.

Eine besondere Aufgabe der vorliegenden Erfindung war es, niedrigviskose Zubereitungen auf Basis feindisperser Systeme vom Typ Öl-in-Wasser mit einem möglichst niedrig n Emulgatorgehalt zur Verfügung zu stellen, welche nicht die Nachteile des Standes der Technik aufweisen und welche für verschiedenste kosmetische und/oder dermatologische Anwendungen, beispielsweise die vorab beschriebenen Verwendungen finden können. Eine weitere

WO 00/37042

PCT/EP99/10241

(1)

Aufgabe der Erfindung war, das begrenzte Angebot an niedrigviskosen Zubereitungen auf Basis feindisperser lecithinhaltiger Systeme vom Typ Ö-in-Wasser des Standes der Technik zu bereichern.

Lecithinhaltige Mikroemulsionen für kosmetische, pharmazeutische, parenterale Anwendungen sind aus der Literatur bekannt. Tröpfchengrößen unter 100 nm werden durch Hochdruckhomogenisierung entsprechender Makroemulsionen erzielt. Nachteilig ist, daß hier hohe Scherkräfte an den Tröpfchen entstehen und Metallabrieb auftritt, der aus den entspr. Darreichungsformen nur schwer entfernt werden kann. Ferner kann auch Ultraschall zur Herstellung entspr. Mikroemulsionen genutzt werden. Nachteilig ist, daß diese Verfahren wegen des hohen Energieeintrags teuer sind.

Mitunter nachteilig bei bekannten, keine Phospholipide enthaltenden O/W-Mikroemulsionen ist, daß sie nicht immer voll befriedigende Pflegeeffekte (Hautbefeuchtung, Hautrauhigkeitsreduktion, Hautschuppigkeitsreduktion) aufweisen.

Ferner werden Mikroemulsionen mit Lecithin in Gegenwart hoher Konzentration an kurzkettigen Alkoholen, Alkandiolen, Aminen erhalten, die für kosmetische, pharmazeutische, parenterale Anwendungen nicht geeignet sind.

Hochdruckhomogenisierung oder Ultraschall zur Herstellung parenteraler Emulsionen, für kosmetische oder pharmazeutische Anwendungen sind in der Literatur beschrieben.

Int. J. Pharm. 163, 1998, 81; J. Pharm. Belg. 52, 1997, 110; J. Pharm. Sci. 82, 1993, 1069; J. Pharm. Sci. 83, 1994, 72; Parf. und Kosmet. 10, 1994, 652; 3, 1995, 152; Pharm. Res. 12, 1995, 1273; SÖFW 9, 1994, 530.

Phospholipid-O/W-Mikroemulsionen mit Cosolventien wie kurzkettigen Alkoholen (Propanol, Butanol, Ethanol, Isopropanol, sec-Butanol, tert-Butanol, n-Pentanol); Alkandiolen, kurzkettigen Alkylethern oder Aminen sind in der Literatur beschrieben.

Int. J. Pharm. 125, 1995, 107; Int. J. Pharm. 111, 1994, 63; Int. J. Pharm. 161, 1993, 161; Int. J. Pharm. 106, 1994, 51; Int. J. Pharm. 116, 1995, 253; Int. J. Pharm. 84, 1992, R5-R8; J. Phys. Chem. 95, 1991, 989, Langmuir 14, 1998, 3506; Langmuir 11, 1995, 1576; SÖFW 124, 1998, 614-623.

Phospholipid-O/W-Mikroemulsionen mit grenzflächenaktiven Pharmaka sind in der Literatur beschrieben.

Int. J. Pharm. 125, 1995, 231; Int. J. Pharm. 89, 1993, R9-R12.

WO 00/37042

PCT/EP99/10241

11

Niedrigviskose Mikroemulsionen für orale Anwendungen auf Basis von Lecithin/Ethanol/Proylenglycol werden in WO 92/02207 beschrieben. Es wird dort ferner die Verdickung zum Mikroemulsionsgel mit Gelatine als wasserlöslichem Polymer beschrieben. Nachteil für kosmetische Anwendungen ist das Fehlen einer kosmetischen Ölphase.

Der Einsatz von Ethanol als amphiphiles Cosolvens zur Herstellung von lecithinhaltigen Mikroemulsionen sowie die Gelierung mit Polysacchariden wie Gelatine oder Agar wird auch in WO 95/31969 beschrieben.

Mit Gelatine verdickte lecithinhaltige transparente Öl-in-Wasser-Emulsionen sind auch in FR 2618351 beschrieben. Die Transparenz wird durch Angleichung der Brechungsindices von Wasser und Ölphase erreicht. Es liegt hier demnach keine Mikroemulsion vor.

EP 406162 B1 beschreibt ein Verfahren zur Herstellung einer Nanoemulsion mit Triglyceriden oder Fettsäureestern. Auf S. 2, Z. 36-43 und auf S. 3 Z. 18-28 wird darauf abgehoben, daß der Emulgator Lecithin eine lamellare flüssigkristalline Struktur aufweisen soll, die dann mit einem Hochdruckhomogenisator zur Nanoemulsion verarbeitet wird.

DE 3930928 C2 beschreibt Cyclosporin enthaltene pharmazeutische Formulierungen. Als Mikroemulsionskonzentrat wird neben Cyclosporin als Wirkstoff vorteilhaft Propylenglycol oder Glycofurol als hydrophile Komponente verwendet. Auf Seite 6 Zeile 7 bis 12 wird ausgeführt, daß diese Konzentrate O/W- oder W/O-Makroemulsionen darstellen. Der vorteilhaft zu durchlaufende Gelzustand, der nicht als Makroemulsion aufzufassen ist, wird nicht erwähnt. In den Beispielen werden im wesentlichen ethoxylierte Emulgatoren verwendet, lecithinhaltige Rezepturen und die Verfahrensweise in der Herstellung der dieser Anmeldung zugrunde liegenden Erfindung werden bis auf Bsp 1.4 nicht erwähnt. Ferner sind für kosmetische Zwecke kurzkettige Ether wie Transcutol und Glycofurol auf Grund der Penetration wenig geeignet.

EP 0100448 und DE 3225706 beschreiben phospholipidhaltige Mikroemulsionen, bestehend aus einem ethoxylierten Glycerinester, Phospholipid und einer Ölphase. Als Ölphase werden Isopropylpalmitat, Glyceryltriacetat oder Miglyole verwendet. Die lipophile Phase wird mit Phospholipid und O/W-Emulgator vermischt und anschließend mit Wasser verdünnt. Ein Gelzustand wird dabei intermediär nicht durchlaufen. Als kurzkettiger Alkohol wird Ethanol bzw. Isopropanol verwendet. Diese Inhaltsstoffe sind als Penetrationsbeschleuniger bekannt und daher von Nachteil.

WO 00/37042

PCT/EP99/10241

12

EP 0760237 beschreibt pharmazeutische Präkonzentrate, die aus Mono-, Di-, Triglyceriden als Ölphase, pharmazeutischem Wirkstoff sowie einem Phospholipid und einem weiteren Emulgator bestehen. Die Verdünnung des Konzentrats in Wasser liefert O/W-Mikroemulsionen. Insbesondere sollen die so hergestellten Rezepturen verhindern, daß der Wirkstoff Cyclosporin nachträglich als Niederschlag ausfällt. Nachteilig ist, daß nur Kokusöl, Castoröl oder Arachisöl als Ölphasen verwendet werden. Ein intermediärer Gelzustand wird nicht durchlaufen.

WO 9709964 beschreibt Mischungen aus Phospholipiden und hydrophilen Surfactants, die neben der Ölphase einen „Surfactant film modifier“ enthalten. Bei diesem handelt es sich bevorzugt um Ethanol oder einen C-3-Alkohol. Auf Seite 7, Zeile 1-4 wird ausgeführt, daß die verwendeten Mischungen zwei bis 3 Tage äquilibriert werden müssen, was als Nachteil angesehen werden kann. Als Ölphase wird in den Beispielen nur Miglyol 810 (kurzkettiges Triglycerid) und Isopropylmyristat verwendet. Die Erzeugung der Mikroemulsion über einen intermediären Gelzustand wird nicht offenbart.

WO 97/30695 beschreibt Mikroemulsionen für intravenöse Zwecke.

Dabei werden zunächst Konzentrate erstellt, die aus Phospholipiden, Propylenglycol (oder PEG), einem Emulgator mit hohem HLB-Wert, einem Wirkstoff und 0-30% Wasser bestehen. Als Ölkomponenten werden Triglyceride oder auch Propylenglycoldiester verwendet.

Auf Seite 6 Zeile 11-13 wird auf das besonders vorteilhaft zu verwendene Propylenglycol hingewiesen. Dies kann auch durch teilweise oder vollständig durch Polyethylenglycol substituiert werden (S.10, Z.18-19). Alkohole wie Ethanol sind für intravenöse Zwecke weniger geeignet. Auf Seite 23 Z. 23-25 und Seite 24, Z. 4-5 wird ausgeführt, wie bedeutend das Propylenglycol zur Herstellung transparenter Zubereitungen ist. Rezepturen ohne Propylenglycol ergeben milchig, opake Emulsionen nach der Verdünnung mit Wasser. Der Vorteil eines Gelzustands wird nicht erkannt.

EP 852941 beschreibt Nanodispersionen, die durch Auflösen des Phospholipids in Ethanol und anschließendem Versatz mit einem ungesättigten ethoxyliertem Sorbitanester und einem Wirkstoff (oder Ölphase) entstehen.

Nachteilig ist, daß Ethanol verwendet werden muß, der insbesondere zu einer verstärkten Penetration in die Haut führen kann bzw. die positiven Eigenschaften der Phospholipide teilweise oder ganz aufheben kann, da Ethanol austrockend wirkt. Ferner werden nur Triglyceride mit dem vorgestellten Verfahren solubilisiert. Nachteilig ist, daß nur Sorbitanester, insbesondere ungesättigte, verwendet werden können, so daß nach sehr

WO 00/37042

PCT/EP99/10241

13

wirksamen Antioxidantien zum Produktschutz der ohnehin schon zu stabilisierenden Phospholipide (wenn ungesättigte eingesetzt werden sollen) gesucht werden muß.

Die gleichen Nachteile ergeben sich in WO 96/37192, in der Sphingo- und Glycolipide solubilisiert werden.

EP 958851 beschreibt Nanodispersionen, die auf zwei unterschiedliche Arten hergestellt werden können. Das erste Verfahren betrifft das Mischen eines membranbildenden Moleküls (Phospholipid), eines Coemulgators (ethoxliert) und eines lipophilen Bestandteils (Ölphase oder Wirkstoff), die gemischt werden, bis eine homogene, klare Lösung entsteht (Nanodispersionsvorphase). Diese Vorphase wird ohne Energieeintrag in eine Wasserphase eingetragen (Seite 2, Zeile 35-50). Auf Seite 2, Zeile 51-52 wird ausgeführt, daß Wasser nicht nötig ist für das Mischen des Phospholipid/Coemulgator/Ölphasen-Gemisches. Der Vorteil der Wasserzugabe und die damit induzierte Bildung eines Gelzustands (d.h. die vorteilhafte Bildung einer Mesophase) wurde nicht erkannt. Das zweite Verfahren unterscheidet sich vom ersten dadurch, daß die Vorphase zusätzlich Propylenglycol oder Ethanol erhält. In den Beispielen zur Herstellung von Nanodispersionen werden als typische Ölphase nur Triglyceride eingesetzt, was von Nachteil ist. Der Zusatz eines lipophilen Coemulgators, der denn Verzicht auf Ethanol ermöglicht, wird nicht beschrieben.

DE 3225706 beschreibt flüssige Wirkstoffformulierungen in Form von Konzentraten für Mikroemulsionen. Es wird beschrieben, daß neben Phospholipid ein O/W-Coemulgator mit einem HLB-Wert von 12-18 eingesetzt wird. Der erfindungsgemäß zu durchlaufende Gelzustand bei der Herstellung der Mikroemulsion wird nicht beschrieben. Die breite Variabilität des Einsatzes verschiedener Ölphasen, die sich durch die Verwendung eines W/O-Emulgators oder durch den Einsatz anderer als die beschriebenen O/W-Emulgatoren ergeben sowie die vorteilhafte Kombination eines O/W-Emulgators und eines W/O-Emulgators neben einem Phospholipid wird nicht beschrieben. Die mit dem Einsatz von Ethanol für Mikroemulsionen verbundenen Nachteile wie Hautaustrocknung, verstärkte Penetration, werden nicht beschrieben.

DE 3302898 beschreibt ein emulgierendes System, das eine Fettsäure oder ein Proteinkondensat, ein polyethoxyliertes Sterin und ein Phosphatid enthält. Auf Seite 6, Zeile 25 wird ausgeführt, daß unter Emulsoiden Emulsionen verstanden werden, deren Teilchengröße kleiner als ein Micron ist. Dem Fachmann ist bekannt, daß es feinteiligere Emulsionen (z.B. PIT-Emulsionen) gibt, deren Tröpfchengröße klein r ein Micron sein kann. Ferner wird die beschriebene Gelbildung nicht ausgenutzt zur Ausbildung einer O/W-Mikroemulsion.

WO 00/37042

PCT/EP99/10241

14

WO 9405298 beschreibt „Submicron Emulsions„ für Anwendungen am Auge. Die Reduktion der Tröpfchengröße erfolgt durch Homogenisierung einer grobteiligen Emulsion bei einem Druck von 8000 psi und anschließender Filtration (S. 14, Z. 18-24). Nachteilig ist, daß hier auf Hochdruckhomogenisierung nicht verzichtet werden kann.

Ferner sind Mikroemulsionen mit kationischen Inhaltstoffen bekannt, die als Konditioniermittel die Frisierbarkeit des Haares erleichtern. Nachteilig ist hier die Verwendung der kationischen Additive.

Lecithin-Organogele werden in der Literatur beschrieben. Colloid Polymer Science 268, 1990, 356; Colloid J. 58, 1996, 117; Colloid Polym. Sci. 268, 1990, 356; Int. J. Pharm. 137, 1996, 117; J. Phys. Chem. 92, 1988, 829; J. Pharm Sci. 81, 1992, 871; J. Contr. Rel. 34, 1995, 53; Proced. Intern. Symp. Control. Rel. Bioact. Mater. 17, 1990, 421; Progr. Colloid Polym. Sci. 105, 1997, 204; Progr. Colloid Polym. Sci. 106, 1997, 228; Skin. Pharmacol. 9, 1996, 124.

Diese emulgatorfreien Organogele erhält man durch Zugabe kleiner Mengen an Wasser zu einer Mischung aus organischem Solvens und Lecithin. Dabei entstehen aus inversen Micellen bei Wasserzugabe zylinderartige wassergefüllte Micellen („wormlike micelles„), die miteinander verschlaufen und so die hohe Viskosität dieser Mischungen erklären. (Colloid Polym. Sci. 268, 1990, 356).

Diese Lecithingele stellen genau genommen keine Mikroemulsionsgele dar, da die dispergierte Phase nicht in Tröpfchenform vorliegt und ferner eine entsprechende viskositäterhöhende Substanz für die kontinuierliche Phase fehlt. Ferner wird nicht beschrieben, daß diese Gele des Standes der Technik sich auch in Gegenwart eines O/W-Emulgators erhalten lassen. Ferner wird nicht beschrieben, daß diese Gele sich auch in Gegenwart eines O/W-Emulgators oder eines W/O-Emulgators erhalten lassen. Ferner wird nicht beschrieben, daß die Gele des Standes der Technik in Gegenwart von Wasser in andere kolloidchemische Phasen überführt werden können wie z.B. O/W-Mikroemulsionen und O/W-Makroemulsionen. Es wird nicht beschrieben, daß sich in Gegenwart eines O/W-Emulgators gelartige Zubereitungen erhalten lassen, die sich gezielt durch Verdünnen mit Wasser in niedrigviskose, lecithinhaltige O/W-Mikroemulsionen überführen lassen. Es wird nicht beschrieben, daß sich in Gegenwart eines O/W-Emulgators oder eines W/O-Emulgators gelartige Zubereitungen erhalten lassen, die sich gezielt durch Verdünnen mit Wasser in niedrigviskose, lecithinhaltige O/W-Mikroemulsionen überführen lassen.

Aufgabe der Erfindung war, die genannten Nachteile zu vermeiden.

WO 00/37042

PCT/EP99/10241

15

Diese Aufgabe wird erfindungsgemäß gelöst.

Gegenstand der Erfindung sind Gele oder niedrigviskose transparente oder transluzente Mikroemulsionen vom Typ Öl-in-Wasser, umfassend eine Wasserphase und eine Ölphase, welche im wesentlichen aus schwerflüchtigen Bestandteilen zusammengesetzt sind, enthaltend:

Mindestens ein Phospholipid und mindestens einen Öl-in-Wasser Emulgator und gegebenenfalls mindestens einen W/O-Emulgator, erhältlich auf die Weise, daß die Wasserphase mit ihren Bestandteilen zu der Ölphase mit ihren Bestandteilen, insbesondere dem Phospholipid und dem O/W-Emulgator und gegebenenfalls dem W/O-Emulgator gegeben wird, wobei die Phasen miteinander vermischt werden und ein Gelzustand erhalten wird, und wenn eine niedrigviskose O/W-Mikroemulsion gewünscht wird, weitere Teile der Wasserphase zugegeben werden und die Phasen vermischt werden, wobei die Phasen gewünschtenfalls weitere Hilfs-, Zusatz- und/oder Wirkstoffe enthalten können.

Gegenstand der Erfindung ist auch ein Verfahren zur Herstellung von Gelen oder niedrigviskosen transparenten oder transluzenten Mikroemulsionen vom Typ Öl-in-Wasser, umfassend eine Wasserphase und eine Ölphase, welche im wesentlichen aus schwerflüchtigen Bestandteilen zusammengesetzt ist, enthaltend mindestens ein Phospholipid und mindestens einen Öl-in-Wasser Emulgator und gegebenenfalls mindestens einen W/O-Emulgator, dadurch gekennzeichnet, daß ein Phospholipid in der Ölphase, gegebenenfalls mit weiteren Bestandteilen, gelöst wird und die Wasserphase, gegebenenfalls mit weiteren Bestandteilen, dazugegeben wird und die Phasen vermischt werden, wobei sich ein Viskositätsanstieg ergibt und z.B. die Gele erhalten werden, und sich bei weiterer Zugabe der Wasserphase die Mikroemulsionen ergeben, wobei der Öl-in-Wasser Emulgator und gegebenenfalls der W/O-Emulgator der Ölphase zugesetzt werden können oder im Stadium der Gelbildung oder auch nach der Herstellung der Gele zugegeben werden können.

Zweckmäßigerweise dosiert oder tropft man die Wasserphase zur Ölphase, z.B. unterrühren, bis ein Viskositätsanstieg erfolgt, bzw. sich ein Gel bildet und dosiert dann die restliche Wasserphase dazu. Das Lecithin wird vorteilhaft in der Ölphase (gegebenenfalls in der Wärme) gelöst. Es ist aber auch möglich, das Lecithin bei Raumtemperatur im Öl zu lösen. Der O/W-Emulgator und gegebenenfalls der W/O-Emulgator können direkt der Ölphase zugesetzt werden oder erst im Stadium der Gelbildung oder nach Herstellung des Lecithin-

WO 00/37042

PCT/EP99/10241

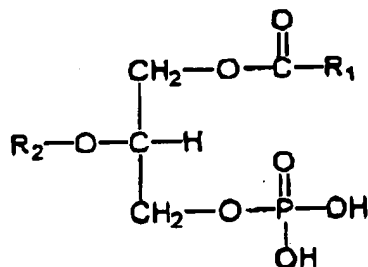
16

Organogels (Phospholid/organisches Solvens/Wasser). Die Wasserphas kann bei Raumtemperatur oder gegebenenfalls bei erhöhter Temperatur zugegeben werden.

Die Komponenten werden vorzugsweise durch Rühren vermischt, gegebenenfalls bei erhöhter Temperatur. Insbesondere kann auf einen Energieeintrag, z.B. durch Homogenisieren, also verzichtet werden.

Mit „Lecithin“ sind in der Beschreibung z.B. auch die Phospholipide, zu denen z.B. die folgenden Stoffe gehören, gemeint: Phosphatidsäuren, die eigentlichen Lecithine, Cardolipine, Lysophospholipide, Lysolecithine, Plasmalogene, Phosphosphingolipide, Sphingomyeline. Bevorzugte Stoffe sind im folgenden beschrieben.

Phosphatidsäuren sind Glycerinderivate, die in 1-sn- und 2-Stellung mit Fettsäuren (1-sn-Position: meist gesättigt, 2-Position: meist ein- oder mehrfach ungesättigt), an Atom 3-sn dagegen mit Phosphorsäure verestert sind und durch die allgemeine Strukturformel



gekennzeichnet.

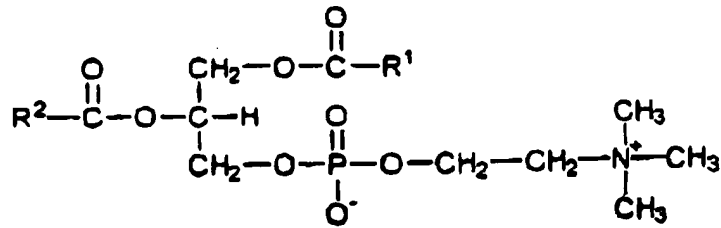
In den in menschlichem oder tierischem Gewebe vorkommenden Phosphatidsäuren ist der Phosphatrest meist verestert mit Aminoalkoholen wie Cholin (Lecithin = 3-sn-Phosphatidylcholin) oder 2-Aminoethanol (Ethanolamin) bzw. L-Serin (Kephalin = 3-sn-Phosphatidylethanolamin bzw. sn-Phosphatidyl-L-serin), mit myo-Inosit zu den in Geweben häufigen Phosphoinositiden [1-(3-sn-Phosphatidyl)-D-myo-inositen], mit Glycerin zu Phosphatidylglycerinen. Besonders bevorzugt werden Lecithine (=3-sn-Phosphatidylcholin).

Lecithine (bzw. die eigentlichen Lecithine) sind z.B. auch durch die allgemeine Strukturformel

WO 00/37042

17

PCT/EP99/10241

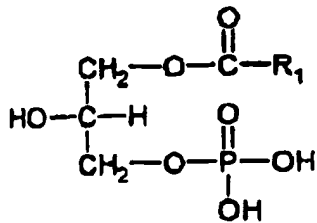


gekennzeichnet, wobei R^1 und R^2 typischerweise unverzweigte aliphatische Reste mit 15 oder 17 Kohlenstoffatomen und bis zu 4 cis-Doppelbindungen darstellen.

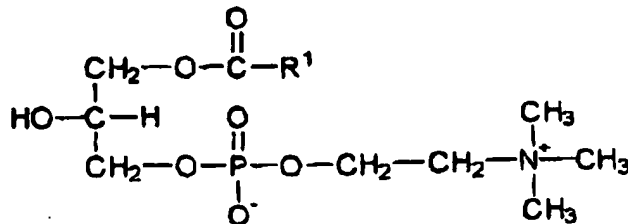
Cardiolipine (1,3-Bisphosphatidylglycerine) sind Phospholipide aus zwei über Glycerin verknüpften Phosphatidsäuren.

Lysophospholipide werden erhalten, wenn aus Phospholipiden ein Acylrest durch Phospholipase A abgespalten wird (z.B. Lysolecithine).

Lysophospholipide sind gekennzeichnet durch die allgemeine Strukturformel



Lysolecithine beispielsweise sind gekennzeichnet durch die allgemeine Strukturformel



wobei R und R^2 typischerweise unverzweigte aliphatische Reste mit 15 oder 17 Kohlenstoffatomen und bis zu 4 cis-Doppelbindungen darstellen.

Bevorzugte Phospholipid sind Phosphatidylcholin, Phosphatidylethanolamin, Phosphatidylinositol oder N-Acylphosphatidylethanolamin oder Gemisch aus zwei oder mehreren dieser Verbindungen.

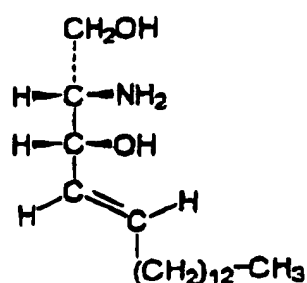
WO 00/37042

18

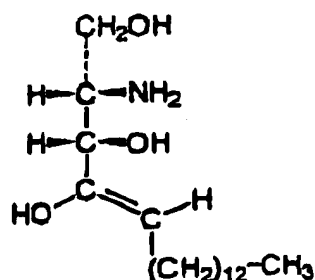
PCT/EP99/10241

Zu den Phospholipide werden auch Plasmalogene gezählt, in denen statt einer Fettsäure in 1-Stellung ein Aldehyd (in Form eines Enoethers) gebunden ist; die den Phosphatidylcholinen entsprechenden O-1-sn-Alkenyl-Verb. z. B. heißen Phosphatid-alcholine.

Den Phosphosphingolipiden liegt als Grundstruktur das Sphingosin oder auch das Phytosphingosin zugrunde, welche sich durch folgende Strukturformeln auszeichnen:

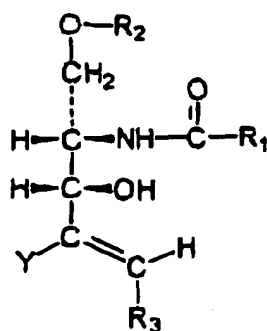


(Sphingosin)



(Phytosphingosin)

Abwandlungen von Sphingolipiden zeichnen sich beispielsweise aus durch die allgemeine Grundstruktur



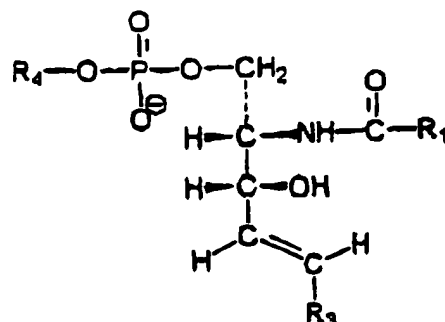
bei welcher R_1 und R_3 unabhängig voneinander gesättigte oder ungesättigte, verzweigte oder unverzweigte Alkylreste von 1 bis 28 Kohlenstoffatomen darstellen, R_2 gewählt wird aus der Gruppe: Wasserstoffatom, gesättigte oder ungesättigte, verzweigte oder unverzweigte Alkylreste von 1 bis 28 Kohlenstoffatomen, Zuckerreste, mit organischen Resten veresterte oder unveresterte Phosphatgruppen, mit organischen Resten veresterte oder unveresterte Sulfatgruppen und Y entweder ein Wasserstoffatom, eine Hydroxygruppe oder einen anderen heterofunktionellen Rest darstellt.

WO 00/37042

19

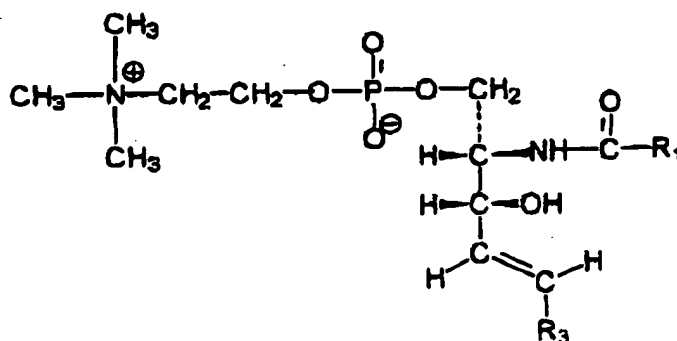
PCT/EP99/10241

Sphingophospholipide:



R₁ und R₃ stellen Alkylreste dar, R₄ stellt einen Organylrest dar.

Sphingomyeline sind organylphosphorylierte Sphingolipide des Typs



Besonders bevorzugte Phospholipide sind Lecithine. Vorteilhaft zu verwendende Lecithintypen werden gewählt aus Rohlecithinen, welche entölt und/oder fraktioniert und/oder sprühgetrocknet und/oder acetyliert und/oder hydrolysiert und/oder hydriert wurden. Sie sind im Handel erhältlich. Bevorzugt werden Sojalecithine.

Erfindungsgemäß vorteilhaft zu verwendende Phospholipide sind beispielsweise käuflich zu erwerben unter den Handelsbezeichnungen Phospholipon 25 (Nattermann), Emulmetik 120 (Lucas Meyer), Stempur E (Stern), Stempur PM (Stern), Nathin 3KE (Stern), Phospholipon 90 (Rhône-Poulenc), Phospholipon 90 H (Rhône-Poulenc).

In Gegenwart des O/W-Emulgators können neuartige Gele, in denen auch andere kolloidchemische Phasen vorliegen, entstehen, als in den in der Literatur bekannten „reinen“ Lecithin-Organogelen wie beispielsweise lamellare Flüssigkristalle, kubische Phasen,

WO 00/37042

PCT/EP99/10241

20

bikontinuierliche Mikroemulsionsgele, O/W-Mikroemulsionsgele, invers hexagonal Phasen, hexagonale Phasen, invers micellare Phasen, WO-Mikroemulsionsgele.

Alle diese durch einen Viskositätsanstieg ausgezeichneten, z.B. cremartigen Zubereitungen werden hier als „Gele“ bezeichnet. Bei weiterer Zugabe der Wasserphase zum Gel nimmt die Viskosität ab und es bildet sich eine niedrigviskose O/W-Mikroemulsion.

Die erfindungsgemäße bevorzugte intermediäre Gelbildung (d.h. die entsprechende kolloidchem. Phase) und ihr gezielter Abbau durch Verdünnung mit Wasser (d.h. die Umwandlung der kolloidchem Phase in eine andere) ermöglicht die Herstellung feintelliger O/W-Mikroemulsionen. Auf diese Weise wird es erstmals möglich, eine Vielzahl von O/W-Emulgatoren einzusetzen. Ferner begünstigt die höhere Variabilität bei der Auswahl an O/W-Emulgatoren eine größere Vielfalt an kosmetischen Ölphasen. Der Zusatz von W/O-Emulgatoren ist dann vorteilhaft, wenn Stabilitätsprobleme auftreten oder Wirkstoffe schwer zu solubilisieren sind. Ferner kann dadurch auf Ethanol verzichtet werden, so daß die hautaustrocknenden oder zu stark penetrationsfördernden Nachteile des Darreichungssystems des Standes der Technik vermieden werden.

Auf diese Weise lassen sich eine größere Zahl an Wirkstoffen, die sich zum Beispiel durch ihre Polarität oder ihre Hydrophilie/Lipophilie unterscheiden, leichter in O/W-Mikroemulsionen einarbeiten.

Im folgenden werden geeignete O/W-Emulgatoren beschrieben.

Ethoxylierte Fettsäureester und Fettsäureglyceride, insbesondere
PEG-50 hydrogenated Castor Oil Isostearat
PEG-45 Palmkernöl Glycerides

Polyglycerinester, insbesondere
Polyglycerin-10 Stearat
Polyglycerin-10 Laurat

Ethoxylierte Glycerinester, insbesondere
PEG-20 Glyceryl Laurat
PEG-20 Glyceryl Steart

Fettsäure-Ethoxylate, insb. sondern
PEG-20 Monostearat

WO 00/37042

21

PCT/EP99/10241

Fettalkohol-Ethoxylate, insbesondere

Ceteareth-12

Oleth- 15

Alkylethersulfate, Ether-Carboxylate, insbesondere

Na-lauryl ether-sulfat

Sulfatierte Glycerinester, insbesondere

Na-Glycerylkoisulfate, Ammonium Glycerylkoisulfat

Acyl-Lactylate, Acyl-Sarcosinate, Acyl-Glutamate, , insbesondere

Na-lauroyl-Lactylat

Auch Sorbitanester oder deren Derivate, z.B.

Ethoxilierte Sorbitanester, insbesondere

PEG- 20 Sorbitan Isostearat

PEG-20 Sorbitan Monooleat können gegebenenfalls verwendet werden.

Die folgenden OW-Emulgatoren werden bevorzugt.

Vorteilhaft werden der polyethoxilierte oder polypropoxilierte bzw. polyethoxilierte und polypropoxilierte OW-Emulgator oder die polyethoxilierten bzw. polypropoxilierten bzw. polyethoxilierten und polypropoxilierten OW-Emulgatoren verwendet, welche gewählt werden können aus der Gruppe

- der Fettalkoholethoxylate der allgemeinen Formel $R-O-(CH_2-CH_2-O)_n-H$, wobei R einen verzweigten oder unverzweigten Alkyl- oder Alkenylrest und n eine Zahl von 10 bis 50 darstellen
- der ethoxilierten Wollwachsalkohole,
- der Polyethylenglycolether der allgemeinen Formel $R-O-(CH_2-CH_2-O)_n-R'$, wobei R und R' unabhängig voneinander verzweigte oder unverzweigte Alkyl- oder Alkenylreste und n eine Zahl von 10 bis 80 darstellen
- der Fettsäureethoxylate der allgemeinen Formel $R-COO-(CH_2-CH_2-O)_n-H$, wobei R einen verzweigten oder unverzweigten Alkyl- oder Alkenylrest und n eine Zahl von 10 bis 40 darstellen,

WO 00/37042

PCT/EP99/10241

22

- der veretherten Fettsäureethoxylate der allgemeinen Formel $R-COO-(-CH_2-CH_2-O)_n-R'$, wobei R und R' unabhängig voneinander verzweigte oder unverzweigte Alkyl- oder Alkenylreste und n eine Zahl von 10 bis 80 darstellen,
- der veresterten Fettsäureethoxylate der allgemeinen Formel $R-COO-(-CH_2-CH_2-O)_n-C(O)-R'$, wobei R und R' unabhängig voneinander verzweigte oder unverzweigte Alkyl- oder Alkenylreste und n eine Zahl von 10 bis 80 darstellen,
- der Polyethylenglycolglycerinfettsäureester gesättigter und/oder ungesättigter, verzweigter und/oder unverzweigter Fettsäuren und einem Ethoxylierungsgrad zwischen 3 und 50,
- der ethoxylierten Sorbitanester mit einem Ethoxylierungsgrad von 3 bis 100
- der Cholesterinethoxylate mit einem Ethoxylierungsgrad zwischen 3 und 50,
- der ethoxylierten Triglyceride mit einem Ethoxylierungsgrad zwischen 3 und 150,
- der Alkylethercarbonsäuren der allgemeinen Formel $R-O-(-CH_2-CH_2-O)_n-CH_2-COOH$ bzw. deren kosmetisch oder pharmazeutisch akzeptablen Salze, wobei R einen verzweigten oder unverzweigten Alkyl- oder Alkenylrest mit 5 - 30 C-Atomen und n eine Zahl von 10 bis 30 darstellen,
- der Polyoxyethylensorbitolfettsäureester, basierend auf verzweigten oder unverzweigten Alkan- oder Alkensäuren und einen Ethoxylierungsgrad von 5 bis 100 aufweisend, beispielsweise vom Sorbeth-Typ,
- der Alkylethersulfate bzw. die diesen Sulfaten zugrundeliegenden Säuren der allgemeinen Formel $R-O-(-CH_2-CH_2-O)_n-SO_3-H$ mit kosmetisch oder pharmazeutisch akzeptablen Kationen, wobei R einen verzweigten oder unverzweigten Alkyl- oder Alkenylrest mit 5 - 30 C-Atomen und n eine Zahl von 1 bis 50 darstellen,
- der Fettalkoholpropoxylate der allgemeinen Formel $R-O-(-CH_2-CH(CH_3)-O)_n-H$, wobei R einen verzweigten oder unverzweigten Alkyl- oder Alkenylrest und n eine Zahl von 10 bis 80 darstellen,
- der Polypropylenglycolether der allgemeinen Formel $R-O-(-CH_2-CH(CH_3)-O)_n-R'$, wobei R und R' unabhängig voneinander verzweigte oder unverzweigte Alkyl- oder Alkenylreste und n eine Zahl von 10 bis 80 darstellen
- der propoxylierten Wollwachsalkohole,
- der veretherten Fettsäurepropoxylate der allgemeinen Formel

WO 00/37042

PCT/EP99/10241

23

- $R-COO-(-CH_2-CH(CH_3)-O-)_n-R'$, wobei R und R' unabhängig voneinander verzweigte oder unverzweigte Alkyl- oder Alkenylreste und n eine Zahl von 10 bis 80 darstellen,
- der veresterten Fettsäurepropoxylate der allgemeinen Formel $R-COO-(-CH_2-CH(CH_3)-O-)_n-C(O)-R'$, wobei R und R' unabhängig voneinander verzweigte oder unverzweigte Alkyl- oder Alkenylreste und n eine Zahl von 10 bis 80 darstellen,
 - der Fettsäurepropoxylate der allgemeinen Formel $R-COO-(-CH_2-CH(CH_3)-O-)_n-H$, wobei R einen verzweigten oder unverzweigten Alkyl- oder Alkenylrest und n eine Zahl von 10 bis 80 darstellen,
 - der Polypropylenglycolglycerinfettsäureester gesättigter und/oder ungesättigter, verzweigter und/oder unverzweigter Fettsäuren und einem Propoxylierungsgrad zwischen 3 und 80
 - der propoxylierten Sorbitanester mit einem Propoxylierungsgrad von 3 bis 100
 - der Cholesterinpropoxylate mit einem Propoxylierungsgrad von 3 bis 100
 - der propoxylierten Triglyceride mit einem Propoxylierungsgrad von 3 bis 100
 - der Alkylethercarbonsäuren der allgemeinen Formel $R-O-(-CH_2-CH(CH_3)-O-)_n-CH_2-COOH$ bzw. deren kosmetisch oder pharmazeutisch akzeptablen Salze, wobei R einen verzweigten oder unverzweigten Alkyl- oder Alkenylrest und n eine Zahl von 3 bis 50 darstellen,
 - der Alkylethersulfate bzw. die diesen Sulfaten zugrundeliegenden Säuren der allgemeinen Formel $R-O-(-CH_2-CH(CH_3)-O-)_n-SO_3-H$ mit kosmetisch oder pharmazeutisch akzeptablen Kationen, wobei R einen verzweigten oder unverzweigten Alkyl- oder Alkenylrest mit 5 - 30 C-Atomen und n eine Zahl von 1 bis 50 darstellen,
 - der Fettalkoholethoxylate/propoxylate der allgemeinen Formel $R-O-X_n-Y_m-H$, wobei R einen verzweigten oder unverzweigten Alkyl- oder Alkenylrest darstellen, wobei X und Y nicht identisch sind und jeweils entweder eine Oxyethylengruppe oder eine Oxypropylengruppe und n und m unabhängig voneinander Zahlen von 5 bis 50 darstellen,
 - der Polypropylenglycolether der allgemeinen Formel $R-O-X_n-Y_m-R'$, wobei R und R' unabhängig voneinander verzweigte oder unverzweigte Alkyl- oder Alkenylreste darstellen, wobei X und Y nicht identisch sind und jeweils entweder eine Oxyethylengruppe oder eine Oxypropylengruppe und n und m unabhängig voneinander Zahlen von 5 bis 100 darstellen,

WO 00/37042

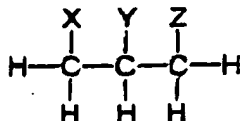
PCT/EP99/10241

24

- der veretherten Fettsäurepropoxylate der allgemein n Formel $R-COO-X_n-Y_m-R'$, wobei R und R' unabhängig voneinander verzweigte oder unverzweigte Alkyl- oder Alkenylreste darstellen, wobei X und Y nicht identisch sind und jeweils entweder eine Oxyethylengruppe oder eine Oxypropylengruppe und n und m unabhängig voneinander Zahlen von 5 bis 100 darstellen.
- der Fettsäureethoxylate/propoxylate der allgemeinen Formel $R-COO-X_n-Y_m-H$, wobei R einen verzweigten oder unverzweigten Alkyl- oder Alkenylrest, wobei X und Y nicht identisch sind und jeweils entweder eine Oxyethylengruppe oder eine Oxypropylengruppe und n und m unabhängig voneinander Zahlen von 5 bis 50 darstellen.
- Diacetylweinsäureester von Mono/Diglyceriden
- Der partiell neutralisierten Ester von Monoglyceriden und/oder Diglyceriden gesättigter Fettsäuren mit alpha-Hydroxysäuren,

Geeignet sind

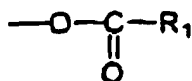
Glycerinester von α -Hydroxycarbonsäuren und gesättigten Fettsäuren, gewählt aus der Verbindungsgruppe, welche durch die generische Formel



repräsentiert wird,

wobei X, Y und Z unabhängig voneinander gewählt werden aus der Gruppe

- (1) OH,
- (2) aus der Gruppe der gesättigten verzweigten und unverzweigten Carbonsäurereste gemäß der Formel



(Formel 2),

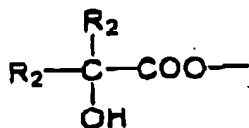
wobei R ein n verzweigten oder unverzweigten Alkylrest mit 10 - 24 C-Atom n darstellt und

- (3) aus der Gruppe der α -Hydroxycarbonsäurereste gemäß der Formel

WO 00/37042

PCT/EP99/10241

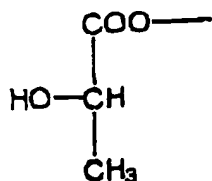
25



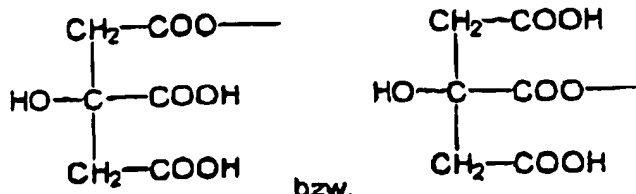
(Formel 3)

- (a) wobei R_2 und R_3 unabhängig voneinander gewählt werden aus der Gruppe
- (a1) $H-$
- (a2) verzweigtes oder unverzweigtes C_{1-25} -Alkyl,
- (a3) mit einer oder mehreren Carboxylgruppen und/oder Hydroxygruppen und/oder Aldehydgruppen und/oder Oxogruppen (Ketogruppen) substituiertes verzweigtes oder unverzweigtes C_{1-25} -Alkyl- oder
- (b) wobei das α -Kohlenstoffatom der α -Hydroxycarbonsäure mit R_2 und R_3 zusammen eine
- (b1) unsubstituierte Cycloalkylgruppe mit 3 bis 7 Ringatomen oder eine
- (b2) mit einer oder mehreren Carboxylgruppen und/oder Hydroxygruppen und/oder Oxogruppen (Ketogruppen) und/oder verzweigten und/oder unverzweigten C_{1-25} -Alkylgruppen substituierte Cycloalkylgruppe mit 3 bis 7 Ringatomen ausbildet,
- und wobei von den Resten X, Y und Z nur einer einen Rest gemäß Formel 3, nur einer einen Rest gemäß Formel 2 und nur einer eine OH-Gruppe darstellen darf.

Besonders vorteilhaft werden die Glycerinester von α -Hydroxycarbonsäuren und gesättigten Fettsäuren im Sinne der vorliegenden Erfindung gewählt aus der Gruppe, bei denen der α -Hydroxycarbonsäurerest einen Milchsäurerest



oder einen Citronensäurerest



WO 00/37042

26

PCT/EP99/10241

darstellt.

Vorteilhaft ist auch, den Fettsäurerest so zu wählen, daß R_1 einen C_{13} - C_{19} -Alkylrest darstellt.

Solche Milchsäureester sind beispielsweise erhältlich unter der Produktbezeichnung „LAC-TODAN B30“ der Gesellschaft Grindsted Prods.

Solche Citronensäureester sind beispielsweise erhältlich unter der Produktbezeichnung „IMWITOR 370“ der Gesellschaft Hüls AG.

- Wasserdispersierbaren W/O-Emulgatoren
- Acyllactylate der Formel

$R-C(O)O-CH(CH_3)-C(O)O-CH(CH_3)CO_2^- M^+$, wobei R eine gesättigte und/oder ungesättigte, verzweigte und/oder unverzweigte Fettsäure mit 6 bis 26 C-Atomen darstellt.

- der Acylglutamate der Formel

$R-C(O)NHCH(COO^- M^+)CH_2CH_2COO^- M^+$, wobei R eine gesättigte und/oder ungesättigte, verzweigte und/oder unverzweigte Fettsäure mit 6 bis 26 C-Atomen darstellt.

- der Acylsarcosinate der Formel

$R-C(O)-N(CH_3)CH_2COO^- M^+$, wobei R eine gesättigte und/oder ungesättigte, verzweigte und/oder unverzweigte Fettsäure mit 6 bis 26 C-Atomen darstellt.

- der Isethionate der Formel

$RC(O)-O-CH_2CH_2-SO_3^- M^+$, wobei R eine gesättigte und/oder ungesättigte, verzweigte und/oder unverzweigte Fettsäure mit 6 bis 26 C-Atomen darstellt.

- der Sulfosuccinate der Formel

$M^+ \cdot O-C(O)-CH_2-CH(SO_3^- M^+)-C(O)-O-R$, wobei R eine gesättigte und/oder ungesättigte, verzweigte und/oder unverzweigte Fettsäure mit 6 bis 26 C-Atomen darstellt.

- der Alaninate der Formel

$CH_3CH_2N(CH_3)(C_{12}H_{25})C(O)O^- M^+$

- der Amphoacetat der Formel

WO 00/37042

PCT/EP99/10241

27



- Alkylglycoside, Alkylpolyglycoside,
- Ester von Hydroxysäuren

Insbesondere bevorzugt sind:

PEG-50 hydrogenated Castor Oil Isostearat, PEG-45 Palmkernöl Glycerides, Polyglycerin-10 Stearat, Polyglycerin-10 Laurat, PEG-20 Glyceryl Laurat, PEG-20 Glyceryl Stearat, PEG-20 Monostearat, Ceteareth-12, Oleth- 15, Na-lauryl ether-sulfat, Natrium-Glycerylkokoylsulfate, Natriumlauryl Lactylat, Natriumcocoylglutamate, Natriumcocoylsarcosinate, PEG- 20 Sorbitan Isostearat, PEG-20 Sorbitan Monooleat, Diacetylweinsäuremono/dilinoleate, Glyceryl Linoleate Citrate, Natriumlaureth-11-carboxylat, Polyethylenglycol(30)Cholesteryl-ether, Polyethylenglycol(60) Evening Primrose Glycerides, Laurylglycosid, C12-C13 alkyl Apfelsäurester, C12-13 Weinsäureester.

Es ist aber auch möglich, in den erfindungsgemäßen Zubereitungen keine Sorbitanester oder Sorbitanesterderivate zu verwenden.

Als Ölphase können die in der Kosmetik üblichen Öle und Fette verwendet werden.

Das erfindungsgemäße Verfahren ermöglicht die Herstellung feinteiliger Mikroemulsionen (die Tröpfchengröße beträgt etwa 10-100 nm) mit einer Vielzahl von typischen Ölphasen: z.B. Ether (Dicaprylylether), Triglyceride (Caprylic/Capric Triglyceride), Alkohole (Octyldodecanol), Esteröle (Cetearyl Isonanoate), Kohlenwasserstoffe (Diethylcyclohexan), Paraffine, Silikonöle (Cyclomethicon) bzw. Mischungen dieser Ölphasen.

Gegebenenfalls kann insbesondere die Ölphase der Zubereitungen auch Sphingolipide und/oder Glycolipide synthetischen oder natürlichen Ursprungs enthalten, insbesondere Ceramide, Sphingomyeline, Cerebroside und/oder Ganglioside.

Der Anteil dieser Lipide kann z.B. 0 bis 10 Gew.-%, vorzugsweise 0 – 2, insbesondere 0 – 1 Gew.-% betragen, jeweils bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen.

Ferner eröffnet das vorgestellte Verfahren die Möglichkeit, auch die vorab beschriebenen viskositätserhöhten Zustände wie z.B. Gele als Darreichungssystem zu nutzen.

WO 00/37042

28

PCT/EP99/10241

So können diese Gele vom Verbraucher zum Beispiel als Haargel appliziert werden. Die Verdünnung dieser Gele führt dann, in Abhängigkeit vom verwendeten O/W-Emulgator und verwendeter Ölphase, zu O/W-Mikro- oder O/W-Makroemulsionen auf der Kopfhaut. Ferner können Duschöle (schäumend, nicht schäumend) unter Ausnutzung erfindungsgemäßer Gelphasen topisch appliziert werden. Das Duschwasser transferiert das Gel auf der Haut in eine wasserkontinuierliche Mikro- oder Makroemulsion. Dabei verbleibt das zugesetzte Phospholipid und weitere Inhaltsstoffe der Zubereitung auf der Haut (rückfettend).

Ferner können diese Gele vorteilhaft zur Entfernung von Hautverunreinigungen verwendet werden. Die Gele besitzen die vorteilhafte Eigenschaft, lipidlösliche Verunreinigungen der Haut zu solubilisieren. Diese Gesichts/Körperreinigungsgele können anschließend mit Wasser vom Verwender verdünnt werden, wobei das Sebum in den Öltröpfchen solubilisiert wird, so daß eine porentiefe Reinigung der Haut ermöglicht wird. Gleichzeitig verbleibt ein Teil des Phospholipids auf der Haut und erhöht so den Feuchtigkeitsgehalt.

Bevorzugt werden für die Gele die folgenden Gew.-%-Mengen, jeweils bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen:

Lecithin:	0,1 – 50%
O/W-Emulgator:	0,1-70%
Ölphase:	5 – 90%
Zusatzstoffe für die Ölphase:	0.01-15%
Zusatzstoffe für die Wasserphase:	0.01-35%
Wasser	0.1-75% Wasser

Lecithin:	0,1 – 40%
O/W-Emulgator:	0,1-70%
W/O-Emulgator:	01.-50%
Ölphase:	5 – 90%
Zusatzstoffe für die Ölphase:	0.01-15%
Zusatzstoffe für die Wasserphase:	0.01-35%
Wasser	0.1-75% Wasser

WO 00/37042

PCT/EP99/10241

29

Bevorzugt werden für die erfindungsgemäßen Mikroemulsionen die folgenden Gewichtsanteile, jeweils bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen:

Lecithin: 0,01 – 10%, insbesondere 0,1 – 5,0%
OW-Emulgator: 0,01- 60%, insbesondere 0,1 – 10%
Ölphase: 0,01 – 50%, insbesondere 0,1 – 30%
Zusatzstoffe für die Ölphase: 0,01-20%, insbesondere 0,1-15%
Zusatzstoffe für die Wasserphase: 0,01-80%, insbesondere 0,1-60%
Wasser: 40-99%

Lecithin: 0,01 – 10%, insbesondere 0,1 – 5,0%
OW-Emulgator: 0,01- 60%, insbesondere 0,1 – 10%
W/O-Emulgator: 0,01-10%, insbesondere 0,1-5,0%
Ölphase: 0,01 – 50%, insbesondere 0,1 – 30%
Zusatzstoffe für die Ölphase: 0,01-20%, insbesondere 0,1-15%
Zusatzstoffe für die Wasserphase: 0,01-80%, insbesondere 0,1-60%
Wasser 40-99%

Zusatzstoffe können auch Hilfsstoffe oder Wirkstoffe sein.

Das Gewichtsverhältnis Lecithin / OW-Emulgator in den erfindungsgemäßen Zubereitungen kann variieren, z.B. von 1:30 bis 2:1. Bevorzugt beträgt das Verhältnis Lecithin / OW-Emulgator 1: 15 bis 1:1. Besonders bevorzugt beträgt das Verhältnis Lecithin / OW-Emulgator 1: 6 bis 1:1.5.

Die erfindungsgemäßen Gele und Mikroemulsionen können gegebenenfalls auch einen oder mehrere Wasser-in-Öl Emulgatoren enthalten.

Die W/O-Emulgatoren sind besonders dann vorteilhaft einzusetzen, wenn zum Beispiel in die Mikroemulsionen Wirkstoffe solubilisiert werden sollen, die nur in Gegenwart des OW-Emulgators und des Lecithins zu Lagerinstabilitäten neigen.

Bevorzugt werden Emulgatoren mit einem HLB-Wert im Bereich von 1-10.

Bevorzugt werden die folgenden W/O-Emulgatoren eingesetzt:

einen oder mehrere polyethoxylierte W/O-Emulgatoren und/oder
einen oder mehrere polypropoxylierte W/O-Emulgatoren und/oder
einen oder mehrere polyethoxylierte und polypropoxylierte W/O-Emulgatoren
und/oder

WO 00/37042

PCT/EP99/10241

30

- einen oder mehrere Monoester, Diester, Polyester von Polyolen als W/O-Emulgatoren und/oder
- einen oder mehrere Monoether von Polyolen und deren Ester als W/O-Emulgatoren und/oder
 - einen oder mehrere Sorbitanester als W/O-Emulgatoren und/oder
 - einen oder mehrere Silikonemulgatoren als W/O Emulgatoren und/oder
 - einen oder mehrere Fettalkohole oder Fettsäuren als W/O-Emulgatoren und/oder
 - einen oder mehrere Methylglucoseester als W/O-Emulgatoren,
- wobei dieser W/O-Emulgator ausgewählt wird aus der Gruppe der
- der Fettalkoholethoxylate der allgemeinen Formel $R-O-(CH_2-CH_2-O)_n-H$, wobei R einen verzweigten oder unverzweigten Alkyl-, Aryl- oder Alkenylrest und n eine Zahl von 1 bis 10 darstellen
 - der Polyethylenglycolether der allgemeinen Formel $R-O-(CH_2-CH_2-O)_n-R'$, wobei R und R' unabhängig voneinander verzweigte oder unverzweigte Alkyl- oder Alkenylreste und n eine Zahl von 1 bis 30 darstellen
 - der Fettsäureethoxylate der allgemeinen Formel $R-COO-(CH_2-CH_2-O)_n-H$, wobei R einen verzweigte oder unverzweigten Alkyl- oder Alkenylrest und n eine Zahl von 1 bis 20 darstellen,
 - der veresterten Fettsäureethoxylate der allgemeinen Formel $R-COO-(CH_2-CH_2-O)_n-C(O)-R'$, wobei R und R' unabhängig voneinander verzweigte oder unverzweigte Alkyl- oder Alkenylreste und n eine Zahl von 1 bis 20 darstellen,
 - der veresterten Fettsäureethoxylate der allgemeinen Formel $R-COO-(CH_2-CH_2-O)_n-C(O)-R'$, wobei R und R' unabhängig voneinander verzweigte oder unverzweigte Alkyl, Hydroxyalkyl - oder Alkenylreste und n eine Zahl von 1 bis 40 darstellen,
 - der veretherten Fettsäureethoxylate der allgemeinen Formel $R-COO-(CH_2-CH_2-O)_n-R'$, wobei R und R' unabhängig voneinander verzweigte oder unverzweigt Alkyl- oder Alkenylreste und n eine Zahl von 1 bis 40 darstel-

WO 00/37042

PCT/EP99/10241

31

len

- der Fettalkoholpropoxylate der allgemeinen Formel $R-O-(CH_2-CH(CH_3)-O)_n-H$, wobei R einen verzweigten oder unverzweigten Alkyl- oder Alkenylrest und n eine Zahl von 1 bis 30 darstellen,
- der Polyoxyethylensorbitanfettsäureester, basierend auf verzweigten oder unverzweigten Alkan- oder Alkensäuren und einen Ethoxylierungsgrad von 1 bis 10 aufweisend
- der Cholesterinethoxylate mit einem Ethoxylierungsgrad zwischen 1 und 10,
- der ethoxlierten Glyceride mit einem Ethoxylierungsgrad von 1 bis 30
- der ethoxlierten Triglyceride mit einem Ethoxylierungsgrad zwischen 1 und 30,
- der Monoglycerinether des Typs $R-O-CH_2-C(H)OH-CH_2OH$ wobei R einen verzweigten oder unverzweigten Alkyl-, Aryl- oder Alkenylrest darstellen und
- der Monoglycerinester des Typs $RC(O)OCH_2-C(H)OH-CH_2OH$ wobei R einen verzweigten oder unverzweigten Alkyl-, Hydroxyalkyl, Aryl- oder Alkenylrest darstellen
- der Diglycerinester des Typs $RC(O)OCH_2-C(H)OH-CH_2OC(O)R'$, wobei R und R' unabhängig voneinander verzweigte oder unverzweigte Alkyl-, Hydroxyalkyl oder Alkenylreste und n eine Zahl von 1 bis 30 darstellen,
- der Polyglycerinmono- oder di- oder polyester, wobei die Fettsäuren unabhängig voneinander verzweigte oder unverzweigte Alkyl-, Hydroxyalkyl oder Alkenylreste darstellen,
- der Pentaerythritester wobei die Fettsäuren unabhängig voneinander verzweigte oder unverzweigte Alkyl-, Hydroxyalkyl oder Alkenylreste darstellen,
- der Propylenglycolester, wobei die Fettsäuren unabhängig voneinander verzweigte oder unverzweigte Alkyl-, Hydroxyalkyl oder Alkenylreste darstellen,

WO 00/37042

PCT/EP99/10241

32

- der Sorbitanester, wobei die Fettsäuren unabhängig voneinander verzweigte oder unverzweigte Alkyl-, Hydroxyalkyl oder Alkenylreste darstellen,
- der Fettalkohole R-OH und Fettsäuren RCOOH, wobei R einen verzweigten oder unverzweigten Alkyl- oder Alkenylrest darstellen,
- der Silikonemulgatoren
- der Methylglucoseester, wobei die Fettsäuren unabhängig voneinander verzweigte oder unverzweigte Alkyl-, Hydroxyalkyl oder Alkenylreste darstellen
- Fettalkohole mit 8 bis 30 Kohlenstoffatomen,
- Diglycerinether wobei die Fettsäuren unabhängig voneinander verzweigte oder unverzweigte Alkyl-, Hydroxyalkyl oder Alkenylreste darstellen
- Sucrosester wobei die Fettsäuren unabhängig voneinander verzweigte oder unverzweigte Alkyl-, Hydroxyalkyl oder Alkenylreste darstellen

Insbesondere vorteilhafte W/O-Emulgatoren sind Glycerylmonistearat, Glycerylmonoisostearat, Diglycerylmonostearat, Diglycerylmonoisostearat, Propylenglycolmonostearat, Sorbitanmonoisostearat, Cetylalkohol, Archidylalkohol, Selachyl-alkohol, Chimylalkohol, Glyccerylmonolaurat, Glycerylmonocaprinat, Glycerylmonocaprylat, Steareth-2, Polyethylenglycol(4)stearat, Polyethylenglycol(12) dilaurat, Polyethylenglycol(8) distearat, Polyethylenglycol(20)sorbitantrioleat, Polyethylenglycol(20)sorbitantrisostearat, Polyethylenglycol(5) Phytosterol, Polyethylen-glycol(20) Glyceryltristearat, Polyethylenglycol(5)glycerylstearat, 2-Ethylhexylglycerin-ether, Polyglyceryl-2 Dipolyhydroxystearat, Cetyldimethiconcopolyol, Isostearinsäure, Linolsäure, Linolensäure.

Das Gewichtsverhältnis Lecithin / (OW-Emulgator und W/O-Emulgator) in den erfindungsgemäßen Zubereitungen kann variieren, z.B. von 1:30 bis 2:1. Bevorzugt beträgt das Verhältnis Lecithin / (OW-Emulgator und W/O-Emulgator) 1: 15 bis 1:1. Besonders bevorzugt beträgt das Verhältnis Lecithin / OW-Emulgator und W/O-Emulgator 1: 6 bis 1:1.5.

Die erfindungsgemäßen Gele oder Mikroemulsionen können hohe Ölphasenanteile besitzen. Sie können insbesondere zur Behandlung der Hautrauigkeit und zur Hautglättung verwendet werden und sie bewirken eine Erhöhung der Hautfeuchtigkeit.

WO 00/37042

PCT/EP99/10241

33

Die im folgenden beschriebenen Zubereitungen können Gele oder Mikroemulsionen gemäß der Erfindung sein.

Die erfindungsgemäßen Gele oder Mikroemulsionen können als Darreichungssysteme für z.B. kosmetische oder z.B. dermatologische Wirkstoffe, Zusatzstoffe, oder Hilfsstoffe verwendet werden. Sie werden vorzugsweise topisch angewendet.

Die erfindungsgemäßen Gele können als Darreichungssystem genutzt werden (Make-up-Entferner, Haargel, Gesichtereinigungsgel, Körperpflegegel). Die erfindungsgemäßen Gele können in Gegenwart von Wasser in andere kolloidchemische Phasen überführt werden, wie z.B. O/W-Mikroemulsionen und O/W-Makroemulsionen. In Gegenwart eines O/W-Emulgators und gegebenenfalls eines W/O-Emulgators lassen sich gelartige Zubereitungen erhalten, die sich gezielt durch Verdünnen mit Wasser in niedrigviskose, lecithinhaltige O/W-Mikroemulsionen überführen lassen.

Stellen die erfindungsgemäßen Gele und Mikroemulsionen Grundlagen für kosmetische Desodorantien/Antitranspirantien dar, so können alle gängigen Wirkstoffe vorteilhaft genutzt werden, beispielsweise Geruchsüberdecker wie die gängigen Parfümbestandteile, Geruchsabsorber, beispielsweise die in der Patentoffenlegungsschrift DE-P 40 09 347 beschriebenen Schichtsilikate, von diesen insbesondere Montmorillonit, Kaolinit, Illit, Beidellit, Nontronit, Saponit, Hectorit, Bentonit, Smectit, ferner beispielsweise Zinksalze der Ricinolsäure. Keimhemmende Mittel sind ebenfalls geeignet, in die erfindungsgemäßen Mikroemulsionen eingearbeitet zu werden. Vorteilhafte Substanzen sind zum Beispiel 2,4,4'-Trichlor-2'-hydroxydiphenylether (Irgasan), 1,6-Di-(4-chlorphenylbiguanido)-hexan (Chlorhexidin), 3,4,4'-Trichlorcarbanilid, quaternäre Ammoniumverbindungen, Nelkenöl, Minzöl, Thymianöl, Triethylcitrat, Farnesol (3,7,11-Trimethyl-2,6,10-dodecatrien-1-ol) sowie die in den Patentoffenlegungsschriften DE-37 40 186, DE-39 38 140, DE-42 04 321, DE-42 29 707, DE-42 29 737, DE-42 37 081, DE-43 09 372, DE-43 24 219 beschriebenen wirksamen Agenzien.

Die üblichen Antitranspiranswirkstoffe können ebenfalls vorteilhaft in den erfindungsgemäßen Mikroemulsionen verwendet werden, insbesondere Adstringentien, beispielsweise basische Aluminiumchlorid.

WO 00/37042

PCT/EP99/10241

34

Die Menge der Desodoranswirkstoffe und/oder Antitranspiranswirkstoffe kann beispielsweise 0,001 bis 50 Gew.-%, vorzugsweise 0,1 bis 35 Gew.-% betragen, jeweils bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitung.

Die erfindungsgemäßen kosmetischen Desodorantien können in Form von Aerosolen, also aus Aerosolbehältern, Quetschflaschen oder durch eine Pumpvorrichtung versprühbaren Präparaten vorliegen oder in Form von mittels Roll-on-Vorrichtungen auftragbaren flüssigen Zusammensetzungen, jedoch auch in Form von aus normalen Flaschen und Behältern auftragbaren Mikroemulsionen.

Als Treibmittel für erfindungsgemäße, aus Aerosolbehältern versprühbare kosmetische Desodorantien sind die üblichen bekannten leichtflüchtigen, verflüssigten Treibmittel, beispielsweise Kohlenwasserstoffe (Propan, Butan, Isobutan) geeignet, die allein oder in Mischung miteinander eingesetzt werden können. Auch Druckluft ist vorteilhaft zu verwenden.

Natürlich weiß der Fachmann, daß es an sich nichttoxische Treibgase gibt, die grundsätzlich für die vorliegende Erfindung geeignet wären, auf die aber dennoch wegen bedenklicher Wirkung auf die Umwelt oder sonstiger Begleitumstände verzichtet werden sollte, insbesondere Fluorchlorkohlenwasserstoffe (FCKW).

Es hat sich darüberhinaus in überraschender Weise herausgestellt, daß bei der Verwendung von in der Ölphase löslichen Treibmitteln, also beispielsweise üblichen Propan-Butan-Gemischen, die erfindungsgemäßen O/W-Mikroemulsionen nicht einfach als Aerosoltröpfchen versprüht werden, sondern sich zu feinblasigen, reichhaltigen Schäumen entwickeln, sobald solche mit solchen Treibmitteln beladenen Systeme Druckentspannung erfahren.

Solche nachschäumenden Zubereitungen werden daher ebenfalls als vorteilhafte Verkörperungen der vorliegenden Erfindung mit eigenständiger erfinderischer Tätigkeit angesehen.

Bei der Verwendung von in der Ölphase unlöslichen Treibmitteln werden die erfindungsgemäßen O/W-Mikroemulsionen als Aerosoltröpfchen versprüht.

WO 00/37042

PCT/EP99/10241

35

Günstig sind auch solche kosmetischen und dermatologischen Zubereitungen, die in der Form eines Sonnenschutzmittels vorliegen. Vorzugsweise enthalten diese neben den erfindungsgemäßen Wirkstoffkombinationen zusätzlich mindestens eine UVA-Filtersubstanz und/oder mindestens eine UVB-Filtersubstanz und/oder mindestens ein anorganisches Pigment.

Es ist aber auch vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindungen, solche kosmetischen und dermatologischen Zubereitungen zu erstellen, deren hauptsächlicher Zweck nicht der Schutz vor Sonnenlicht ist, die aber dennoch einen Gehalt an UV-Schutzsubstanzen enthalten. So werden z.B. in Tagescrèmes gewöhnlich UV-A- bzw. UV-B-Filtersubstanzen eingearbeitet.

Vorteilhaft können erfindungsgemäße Zubereitungen Substanzen enthalten, die UV-Strahlung im UVB-Bereich absorbieren, wobei die Gesamtmenge der Filtersubstanzen z.B. 0,1 Gew.-% bis 30 Gew.-%, vorzugsweise 0,5 bis 10 Gew.-%, insbesondere 1 bis 6 Gew.-% beträgt, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen.

Die UVB-Filter können öllöslich oder wasserlöslich sein. Als öllösliche Substanzen sind z.B. zu nennen:

- 3-Benzylidencampher und dessen Derivate, z.B. 3-(4-Methylbenzyliden)campher,
- 4-Aminobenzoësäure-Derivate, vorzugsweise 4-(Dimethylamino)-benzoësäure(2-ethylhexyl)ester, 4-(Dimethylamino)benzoësäureamylester;
- Ester der Zimtsäure, vorzugsweise 4-Methoxyzimtsäure(2-ethylhexyl)ester, 4-Methoxyzimtsäureisopentylester;
- Ester der Salicylsäure, vorzugsweise Salicylsäure(2-ethylhexyl)ester, Salicylsäure(4-isopropylbenzyl)ester, Salicylsäurehomomenthylester;
- Derivate des Benzophenons, vorzugsweise 2-Hydroxy-4-methoxybenzophenon, 2-Hydroxy-4-methoxy-4'-methylbenzophenon, 2,2'-Dihydroxy-4-methoxybenzophenon;
- Ester der Benzalmalonsäure, vorzugsweise 4-Methoxybenzalmalonsäuredi(2-ethylhexyl)ester;
- 2,4,6-Triänilino-(p-carbo-2'-ethyl-1'-hexyloxy)-1,3,5-triazin

Als wasserlösliche Substanzen sind vorteilhaft:

- 2-Phenylbenzimidazol-5-sulfonsäure und deren Salze, z.B. Natrium-, Kalium- oder Triethanolammonium-Salz ,

WO 00/37042

PCT/EP99/10241

36

- Sulfonsäure-Derivate von Benzophenonen, vorzugsweise 2-Hydroxy-4-methoxybenzophenon-5-sulfonsäure und ihre Salze;
- Sulfonsäure-Derivate des 3-Benzylidencamphers, wie z.B. 4-(2-Oxo-3-bornylidenmethyl)benzolsulfonsäure, 2-Methyl-5-(2-oxo-3-bornylidenmethyl)sulfonsäure und ihre Salze.

Die Liste der genannten UVB-Filter, die erfindungsgemäß Verwendung finden können, soll selbstverständlich nicht limitierend sein.

Gegenstand der Erfindung ist auch die Kombination eines erfindungsgemäßen UVA-Filters mit einem UVB-Filter bzw. eine erfindungsgemäße kosmetische oder dermatologische Zubereitung, welche auch einen UVB-Filter enthält.

Es kann auch von Vorteil sein, in erfindungsgemäßen Zubereitungen UVA-Filter einzusetzen, die üblicherweise in kosmetischen und/oder dermatologischen Zubereitungen enthalten sind. Bei solchen Substanzen handelt es sich vorzugsweise um Derivate des Dibenzoylmethans, insbesondere um 1-(4'-tert. Butylphenyl)-3-(4'-methoxyphenyl)propan-1,3-dion und um 1-Phenyl-3-(4'-isopropylphenyl)propan-1,3-dion. Auch Zubereitungen, die diese Kombinationen enthalten, sind Gegenstand der Erfindung. Es können die gleichen Mengen an UVA-Filtersubstanzen verwendet werden, welche für UVB-Filtersubstanzen genannt wurden.

Erfindungsgemäße kosmetische und/oder dermatologische Zubereitungen können auch anorganische Pigmente enthalten, die üblicherweise in der Kosmetik zum Schutze der Haut vor UV-Strahlen verwendet werden. Dabei handelt es sich um Oxide des Titans, Zinks, Eisens, Zirkoniums, Siliciums, Mangans, Aluminiums, Cers und Mischungen davon, sowie Abwandlungen, bei denen die Oxide die aktiven Agentien sind. Besonders bevorzugt handelt es sich um Pigmente auf der Basis von Titandioxid. Es können die für die vorstehenden Kombinationen genannten Mengen verwendet werden.

Eine erstaunliche Eigenschaft der vorliegenden Erfindung ist, daß erfindungsgemäße Zubereitungen sehr gute Vehikel für kosmetische oder dermatologische Wirkstoffe in die Haut sind, wobei vorteilhafte Wirkstoffe Antioxidantien sind, welche die Haut vor oxidativer Beanspruchung schützen können.

WO 00/37042

PCT/EP99/10241

37

Erfindungsgemäß enthalten die Zubereitungen vorteilhaft eines oder mehrere Antioxidantien. Als günstige, aber dennoch fakultativ zu verwendende Antioxidantien alle für kosmetische und/oder dermatologische Anwendungen geeigneten oder gebräuchlichen Antioxidantien verwendet werden. Es ist dabei vorteilhaft, Antioxidantien als einzige Wirkstoffklasse zu verwenden, etwa dann, wenn eine kosmetische oder dermatologische Anwendung im Vordergrund steht wie die Bekämpfung der oxidativen Beanspruchung der Haut. Es ist aber auch günstig, die erfindungsgemäßen Mikroemulsionen mit einem Gehalt an einem oder mehreren Antioxidantien zu versehen, wenn die Zubereitungen einem anderen Zwecke dienen sollen, z.B. als Desodorantien oder Sonnenschutzmittel.

Besonders vorteilhaft werden die Antioxidantien gewählt aus der Gruppe bestehend aus

Aminosäuren (z.B. Histidin, Tyrosin, Tryptophan) und deren Derivate, Imidazole (z.B. Urocaninsäure) und deren Derivate, Peptide wie D,L-Carnosin, D-Carnosin, L-Carnosin und deren Derivate (z.B. Anserin), Carotinoide, Carotine (z.B. α -Carotin, β -Carotin, Lycopin) und deren Derivate, Liponsäure und deren Derivate (z.B. Dihydroliponsäure), Aurothioglucose, Propylthiouracil und andere Thiole (z.B. Thioredoxin, Glutathion, Cystein, Cystin, Cystamin und deren Glycosyl-, N-Acetyl-, Methyl-, Ethyl-, Propyl-, Amyl-, Butyl- und Lauryl-, Palmitoyl-, Ol yl-, gamma-Linoleyl-, Cholesteryl - und Glycerylester) sowie deren Salze, Dilaurylthiodipropionat, Distearylthiodipropionat, Thiodipropionsäure und deren Derivate (Ester, Ether, Peptide, Lipide, Nukleotide, Nukleoside und Salze) sowie Sulfoximinverbindungen (z.B. Buthioninsulfoximine, Homocysteinsulfoximin, Buthioninsulfone, Penta-, Hexa-, Heptahioninsulfoximin) in sehr geringen verträglichen Dosierungen (z.B. pmol bis μ mol/kg), ferner (Metall)-Chelatoren (z.B. α -Hydroxyfettsäuren, α -Hydroxypalmitinsäure, Phytinsäure, Lactoferrin), α -Hydroxysäuren (z.B. Zitronensäure, Milchsäure, Apfelsäure), Huminsäure, Gallensäure, Gallenextrakte, Bilirubin, Biliverdin, EDTA, EGTA und deren Derivate, ungesättigte Fettsäuren und deren Derivate (z.B. gamma-Linolensäure, Linolsäure, Ölsäure), Folsäure und deren Derivate, Ubichinon und Ubichinol deren Derivate, Vitamin C und Derivate (z.B. Ascorbylpalmitate, Mg - Ascorbylphosphate, Ascorbylacetate), Tocopherole und Derivate (z.B. Vitamin E - acetat), Vitamin A und Derivate (Vitamin A - palmitat) sowie Koniferylbenzoat des Benzoeharzes, Rutinsäure und deren Derivate, Ferulasäure und deren Derivate, Butylhydroxytoluol, Butylhydroxyanisol, Nordihydroguajakharzsäure, Nordihydroguajaretsäure, Trihydroxybutyrophenon, Harnsäure und deren Derivate, Zink und dessen Derivate (z.B. ZnO, ZnSO₄) Selen und dessen Derivate (z.B. Selenmethionin), Stilbene und deren Derivate (z.B. Stilbenoxid, Trans-

WO 00/37042

38

PCT/EP99/10241

Stilbenoxid) und die erfindungsgemäß geeigneten Derivate (Salze, Ester, Ether, Zucker, Nukleotide, Nukleoside, Peptide und Lipide) dieser genannten Wirkstoffe.

Besonders vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung können öllösliche Antioxidantien eingesetzt werden.

Die Menge der Antioxidantien (eine oder mehrere Verbindungen) in den Zubereitungen beträgt vorzugsweise 0,001 bis 30 Gew.-%, besonders bevorzugt 0,05 - 20 Gew.-%, insbesondere 1 - 10 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitung.

Sofern Vitamin E und/oder dessen Derivate das oder die Antioxidantien darstellen, ist vorteilhaft, deren jeweilige Konzentrationen aus dem Bereich von 0,001 - 10 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Formulierung, zu wählen.

Sofern Vitamin A, bzw. Vitamin-A-Derivate, bzw. Carotine bzw. deren Derivate das oder die Antioxidantien darstellen, ist vorteilhaft, deren jeweilige Konzentrationen aus dem Bereich von 0,001 - 10 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Formulierung, zu wählen.

Es ist dem Fachmann natürlich bekannt, daß anspruchsvolle kosmetische Zubereitungen zumeist nicht ohne die üblichen Hilfs- und Zusatzstoffe denkbar sind. Darunter zählen beispielsweise Konsistenzgeber, Füllstoffe, Parfum, Farbstoffe, Emulgatoren, zusätzliche Wirkstoffe wie Vitamine oder Proteine, Lichtschutzmittel, Stabilisatoren, Insektenrepellentien, Alkohol, Wasser, Salze, antimikrobiell, proteolytisch oder keratolytisch wirksame Substanzen usw.

Wenn es gewünscht wird, kann die Wasserphase der erfindungsgemäßen O/W-Mikroemulsionen auch Verdicker enthalten, so daß die Gesamtzubereitung gelartig erscheint und als Mikroemulsionsgel aufzufassen ist. Als geeignete Verdicker haben sich beispielsweise Carrageenane bzw. PEG-4-Rapeseedamide sowie Laureth-2 amid MEA herausgestellt.

Erfindungsgemäß können Wirkstoffe auch sehr vorteilhaft gewählt werden aus der Gruppe der lipophilen Wirkstoffe, insbesondere aus folgender Gruppe:

Acetylsalicylsäure, Atropin, Azulen, Hydrocortison und dessen Derivaten, z.B. Hydrocortison-17-valerat, Vitamine, z.B. Ascorbinsäure und deren Derivate, Vitamin der B- und D-Reihe.

WO 00/37042

PCT/EP99/10241

39

sehr günstig das Vitamin B₁, das Vitamin B₁₂, das Vitamin D₁, aber auch Bisabolol, ungesättigte Fettsäuren, namentlich die essentiellen Fettsäuren (oft auch Vitamin F genannt), insbesondere die gamma-Linolensäure, Ölsäure, Eicosapentaensäure, Docosahexaensäure und deren Derivate, Chloramphenicol, Coffein, Prostaglandine, Thymol, Campher, Extrakte oder andere Produkte pflanzlicher und tierischer Herkunft, z.B. Nachtkerzenöl, Borretschöl oder Johannisbeerkemöl, Fischöle, Lebertran aber auch Ceramide und ceramidähnliche Verbindungen.

Ogleich selbstverständlich auch die Verwendung hydrophiler Wirkstoffe erfindungsgemäß begünstigt ist, ist ein weiterer Vorteil der erfindungsgemäßen Mikroemulsionen, daß die hohe Anzahl feinstzerteilter Tröpfchen gerade öllösliche bzw. lipophile Wirkstoffe mit besonders großer Wirksamkeit biologisch verfügbar macht.

Vorteilhaft ist es auch, die Wirkstoffe aus der Gruppe der rückfettenden Substanzen zu wählen, beispielsweise Purcellinöl, Eucerit[®] und Neocerit[®].

Es ist auch möglich und gegebenenfalls vorteilhaft, den erfindungsgemäßen Zubereitungen waschaktive Tenside zuzufügen. Erfindungsgemäße wäßrige kosmetische Reinigungsmittel oder für die wäßrige Reinigung bestimmte wasserarme oder wasserfreie Reinigungsmittelkonzentrate können kationische, anionische, nichtionische und/oder amphotere Tenside enthalten, beispielsweise herkömmliche Seifen, z.B. Fettsäuresalze des Natriums, Alkylsulfate, Alkylethersulfate, Alkan- und Alkylbenzolsulfonate, Sulfoacetate, Sulfobetaine, Sarcosinate, Amidosulfobetaine, Sulfosuccinate, Sulfobemsteinsäurehalbester, Alkylethercarboxylate, Eiweiß-Fettsäure-Kondensate, Alkylbetaine und Amidobetaine, Fettsäurealkanamide, Polyglycolether-Derivate.

Kosmetische Zubereitungen, die kosmetische Reinigungszubereitungen für die Haut darstellen, können in flüssiger oder halbfester Form vorliegen, beispielsweise als Gele oder Mikroemulsionen. Sie enthalten vorzugsweise mindestens eine anionische, kationische, nicht-ionische oder amphotere oberflächenaktive Substanz oder Gemische daraus, gegebenenfalls Elektrolyte und Hilfsmittel, wie sie üblicherweise dafür verwendet werden. Die oberflächenaktive Substanz kann bevorzugt in einer Konzentration zwischen 1 und 30 Gew.-% in den Reinigungszubereitungen vorliegen, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen.

WO 00/37042

PCT/EP99/10241

40

Kosmetische Zubereitungen, die ein Shampooierungsmittel darstellen, enthalten v rzugsweise mindestens eine anionische, nicht-ionische oder amphotere oberflächenaktive Substanz oder Gemische daraus, gegebenenfalls Elektrolyte und Hilfsmittel, wie sie üblicherweise dafür verwendet werden. Die oberflächenaktive Substanz kann bevorzugt in einer Konzentration zwischen 1 und 50 Gew.-% in den Reinigungszubereitungen vorliegen, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen. Vorteilhaft sind beispielsweise Cetyltrimethylammoniumsalze zu verwenden.

Die erfindungsgemäßen für die Reinigung des Haares oder der Haut vorgesehenen Zubereitungen enthalten außer den vorgenannten Tensiden Wasser und gegebenenfalls die in der Kosmetik üblichen Zusatzstoffe, beispielsweise Parfüm, Verdicker, Farbstoffe, Desodorantien, antimikrobielle Stoffe, rückfettende Agentien, Komplexierungs- und Sequestrierungsagentien, Perlglanzagentien, Pflanzenextrakte, Vitamine, Wirkstoffe und dergleichen.

Die erfindungsgemäßen Zubereitungen haben, trotz ihres Ölgehaltes, in erstaunlicher Weise sehr gute Schaumentwicklung, hohe Reinigungskraft und wirken in hohem Maße regenerierend in bezug auf den allgemeinen Hautzustand. Insbesondere wirken die erfindungsgemäßen Zubereitungen hautglättend, vermindern das Trockenheitsgefühl der Haut und machen die Haut geschmeidig.

Erfindungsgemäß ist es z.B. möglich eine Mischung aus Lecithin/PEG-20 Sorbitanisostearate/Octyldoecanol/Glycerin auf das Haar zu applizieren, sodaß beispielsweise ein Stay-in Conditioner-Produkt entsteht. Ferner können die Produkte auch mit Treibgas versehen und als Schaum ins Haar (oder auf die Haut) appliziert werden.

Erfindungsgemäß ist es auch möglich, eine Mischung aus Lecithin/PEG-20 Sorbitanisostearate/Caprylic/capric Triglycerid/Glycerin topisch zu applizieren und eine signifikante Hautbefeuchtung, Hautgättung und eine Reduktion in der Hautschuppigkeit zu erzielen. Insbesondere ist es auch vorteilhaft anstelle des Triglycerids als Ölphase Octyldodecanol oder Cetearyl Isonanoate oder Diocetyl cyclohexan zu verwenden und die für das Triglycerid beschriebenen Vorteile zu erzielen.

Sollen die erfindungsgemäßen Gele oder Mikroemulsionen zur Haarpflege eingesetzt werden, können sie die üblichen Bestandteile enthalten, üblicherweise zum Beispiel filmbildende Polymere. Von solchen Polymeren mit wenigstens teilweise quaternisierten Stickstoff-

WO 00/37042

PCT/EP99/10241

41

gruppen (im folgenden „Filmbildner, genannt), eigenen sich bevorzugt solche, welche gewählt werden aus der Gruppe der Substanzen, welche nach der INCI-Nomenklatur (International Nomenclature Cosmetic Ingredient) den Namen „Polyquaternium,“ tragen, beispielsweise:

- | | |
|-------------------|---|
| Polyquaternium-2 | (Chemical Abstracts-Nr. 63451-27-4, z.B. Mirapol® A-15) |
| Polyquaternium-5 | (Copolymeres aus dem Acrylamid und dem β -Methacryloxyethyltrimethylammoniummethosulfat, CAS-Nr. 26006-22-4) |
| Polyquaternium-6 | (Homopolymer des N,N-Dimethyl-N-2-propenyl-2-propen-1-aminiumchlorids, CAS-Nr. 26062-79-3, z.B. Merquat® 100) |
| Polyquaternium-7 | N,N-Dimethyl-N-2-propenyl-2-propen-1-aminiumchlorid, Polymeres mit 2-Propenamid, CAS-Nr. 26590-05-8, z.B. Merquat® S |
| Polyquaternium-10 | Quaternäres Ammoniumsalz der Hydroxyethylcellulose, CAS-Nr. 53568-66-4, 55353-19-0, 54351-50-7, 68610-92-4, 81859-24-7, z.B. Celquat® SC-230M, |
| Polyquaternium-11 | Vinylpyrrolidon/dimethylaminoethyl-Methacrylat-Copolymer/Diethylsulfat-Reaktionsprodukt, CAS-Nr. 53633-54-8, z.B. Gafquat® 755N |
| Polyquaternium-16 | Vinylpyrrolidon/vinylimidazoliummethochlorid-Copolymer, CAS-Nr. 29297-55-0, z.B. Luviquat® HM 552 |
| Polyquaternium-17 | CAS-Nr. 90624-75-2, z.B. Mirapol® AD-1 |
| Polyquaternium-19 | Quaternisierter wasserlöslicher Polyvinylalkohol |
| Polyquaternium-20 | in Wasser dispergierbarer quaternisierter Polyvinyl-octadecylether |
| Polyquaternium-21 | Polysiloxan-polydimethyl-dimethylammoniumacetat-Copolymeres, z.B. Abil® B 9905 |
| Polyquaternium-22 | Dimethyldiallylammoniumchlorid/Acrylsäure-Copolymer, CAS-Nr. 53694-7-0, z.B. Merquat® 280 |
| Polyquaternium-24 | Polymeres quaternäres Ammoniumsalz der Hydroxyethylcellulose, Reaktionsprodukt mit einem mit Lauryldimethylammonium substituierten Epoxid, CAS-Nr. 107987-23-5, z.B. Quatrisoft® LM-200 |
| Polyquaternium-28 | Vinylpyrrolidon/Methacrylamidopropyltrimethylammoniumchlorid-Copolymer, z.B. Gafquat® HS-100 |
| Polyquaternium-29 | z.B. Lexquat® CH |
| Polyquaternium-31 | CAS-Nr. 136505-02-7, z.B. Hypan® QT 100 |
| Polyquaternium-32 | N,N,N-trimethyl-2-[(2-methyl-1-oxo-2-propenyl)oxy]-Ethanaminiumchlorid, polymer mit 2-Propenamid, CAS-Nr. 35429-19-7 |

WO 00/37042

PCT/EP99/10241

42

Polyquaternium-37 CAS-Nr. 26161-33-1

Cetyltrimethylamoniumsalze wie CTAB, CTAC.

Vorteilhaft enthalten erfindungsgemäße Zubereitungen zur Haarpflege 0,01 - 5 Gew.-% eines oder mehrerer Filmbildner, bevorzugt 0,1 - 3 Gew.-%, insbesondere 0,2 - 2 Gew.-%, jeweils bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen. Derartige Ausführungsformen der erfindungsgemäßen Zubereitungen pflegen durch Umwelteinflüsse geschädigtes oder strapaziertes Haar bzw. beugen solchen Umwelteinflüssen vor. Ferner verleihen die erfindungsgemäßen Zubereitungen der Haartracht lockere Fülle und Festigkeit, ohne klebrig zu wirken.

Entsprechend können die erfindungsgemäßen Zubereitungen, je nach ihrem Aufbau, beispielsweise verwendet werden als Hautschutzemulsion, Reinigungsmilch, Sonnenschutzlotion, Nährlotion, Tages- oder Nachtemulsion usw.

Die erfindungsgemäßen Mikroemulsionen tragen ferner in vorzüglicher Weise zur Hautglättung bei, insbesondere, wenn sie mit einer oder mehreren Substanzen versehen sind, die die Hautglättung fördern.

Es ist gegebenenfalls möglich und vorteilhaft, die erfindungsgemäßen Zubereitungen als Grundlage für pharmazeutische Formulierungen zu verwenden. Mutatis mutandis gelten entsprechende Anforderungen an die Formulierung medizinischer Zubereitungen. Die Übergänge zwischen reinen Kosmetika und reinen Pharmaka sind dabei fließend. Als pharmazeutische Wirkstoffe sind erfindungsgemäß grundsätzlich alle Wirkstoffklassen geeignet, wobei lipophile Wirkstoffe bevorzugt sind. Beispiele sind: Antihistaminika, Antiphlogistika, Antibiotika, Antimykotika, die Durchblutung fördernde Wirkstoffe, Keratolytika, Hormone, Steroide, Vitamine usw.

Die erfindungsgemäßen kosmetischen und dermatologischen Zubereitungen können kosmetische Hilfsstoffe enthalten, wie sie üblicherweise in solchen Zubereitungen verwendet werden, z.B. Konservierungsmittel, Bakterizide, Viruzide, Parfüme, Substanzen zum Verhindern des Schäumens, Farbstoffe, Pigmente, die färbende Wirkung haben, Verdickungsmittel, oberflächenaktive Substanzen, Emulgatoren, weichmachende, anfeuchtende und/oder feuchthaltende Substanzen, entzündungshemmende Substanzen, Medikamente, Fette, Öle, Wachse oder andere übliche Bestandteile inner kosmetischen oder

WO 00/37042

PCT/EP99/10241

43

dermatologischen Formulierung wie Alkohole, Polyole, Polymere, Schaumstabilisatoren, Elektrolyte, organische Lösungsmittel.

Insbesondere vorteilhaft werden Gemische der vorstehend genannten Lösungsmittel verwendet.

Als weitere Bestandteile können verwendet werden Fette, Wachse und andere natürliche und synthetische Fettkörper, vorzugsweise Ester von Fettsäuren mit Alkoholen niedriger C-Zahl, z.B. mit Isopropanol, Propylenglykol oder Glycerin, oder Ester von Fettalkoholen mit Alkansäuren niedriger C-Zahl oder mit Fettsäuren, Alkohole, Diole oder Polyole niedriger C-Zahl, sowie deren Ether, vorzugsweise Ethanol, Isopropanol, Propylenglykol, Glycerin, Ethylenglykol, Ethylenglykolmonoethyl- oder -monobutylether, Propylenglykolmonomethyl-, monoethyl- oder -monobutylether, Diethylenglykolmonomethyl- oder -monoethylether und analoge Produkte.

Alle Mengenangaben, Prozentangaben oder Teile beziehen sich, soweit nicht anders angegeben, auf das Gewicht der Zubereitungen oder der jeweiligen Mischung.

Die nachfolgenden Beispiele sollen die vorliegende Erfindung verdeutlichen.

Als Lecithin wird in den folgenden Beispielen Phospholipon 90 (Fa. Rhône-Poulenc, FR) verwendet.

An Stelle der ethoxilierten Sorbitanester kann zum Beispiel auch jeweils PEG-50 Hydrogenated Castor Oil Isostearat mit gleichem Erfolg verwendet werden.

Beispiel 1

Gesichtswasser

	Gew.-%
Lecithin	0.5%
PEG-20 Sorbitanisostearate	2.5%
Glycerinisostearate	0.5%
Glycerin	5,000
Cetearyl Isononanoate	2.500
Konservierung	q.s.
Wasser	ad
	100,000

Die Ölphase und die Wasserphase werden getrennt auf je 70 - 75° C erhitzt. Die Wasserphase wird zu der Ölphase getropft und es bildet sich ein Gel. Bei weiterem Zutropfen der Wasserphase und Abkühlen der Mischung entsteht eine O/W-Mikroemulsion.

Beispiel 2

Gesichtswasser

	Gew.-%
Lecithin	0.5%
PEG-20 Sorbitanisostearate	2.5%
Sorbitanisostearate	0.5%
Glycerin	5,000
Cetearyl Isononanoate	2.500
Konservierung	q.s.
Wasser	ad
	100,000

Die Ölphase und die Wasserphase werden getrennt auf je 70 - 75° C erhitzt. Die Wasserphase wird zu der Ölphase getropft und es bildet sich ein Gel. Bei weiterem Zutropfen der Wasserphase und Abkühlen der Mischung entsteht eine O/W-Mikroemulsion.

WO 00/37042

PCT/EP99/10241

45

Beispiel 3

Gesichtswasser

	Gew.-%
Lecithin	0.5%
PEG-20 Sorbitanisostearate	2.5%
Steareth-2	0.5%
Glycerin	5,000
Cetearyl Isononanoate	2.500
Konservierung	q.s.
Wasser	ad
	100,000

Die Ölphase und die Wasserphase werden getrennt auf je 70 - 75° C erhitzt. Die Wasserphase wird zu der Ölphase getropft und es bildet sich ein Gel. Bei weiterem Zutropfen der Wasserphase und Abkühlen der Mischung entsteht eine O/W-Mikroemulsion.

Beispiel 4

Gesichtswasser

	Gew.-%
Lecithin	1.0%
PEG-20 Sorbitanisostearate	2.5%
Phenylbenzimidazolsulfonsäure	3.0%
Natronlauge	1.0%
Glycerin	5,000
Cetearyl Isononanoate	2.500
Konservierung	q.s.
Wasser	ad
	100,000

WO 00/37042

PCT/EP99/10241

46

Die Ölphase und die Wasserphase werden getrennt auf je 70 - 75° C erhitzt. Die Wasserphase wird zu der Ölphase getropft und es bildet sich ein Gel. Bei weiterem Zutropfen der Wasserphase und Abkühlen der Mischung entsteht eine O/W-Mikroemulsion.

Beispiel 5**Gesichtswasser**

	Gew.-%
Lecithin	0.5%
PEG-20 Sorbitanisostearate	2.5%
Glycerinisostearate	0.5%
Glycerin	5.000
Cetearyl Isononanoate	2.500
Konservierung	q.s.
Wasser	ad
	100,000

Die Ölphase und die Wasserphase werden getrennt auf je 70 - 75° C erhitzt. Die Wasserphase wird zu der Ölphase getropft und es bildet sich ein Gel. Bei weiterem Zutropfen der Wasserphase und Abkühlen der Mischung entsteht eine O/W-Mikroemulsion.

WO 00/37042

47

PCT/EP99/10241

Beispiel 6

Gesichtswasser

	Gew.-%
Lecithin	1,800
PEG-50 Hydrogenated Castor Oil Isostearat	5,200
Glycerin	5,000
Dicaprylyl Ether	5,000
Konservierung	q.s.
Wasser	ad
	100,000

Die Ölphase und die Wasserphase werden getrennt auf je 70 - 75° C erhitzt. Die Wasserphase wird zu der Ölphase getropft und es bildet sich ein Gel. Bei weiterem Zutropfen der Wasserphase und Abkühlen der Mischung entsteht eine O/W-Mikroemulsion.

Beispiel 7

Anti-Akne-Lotion

	Gew.-%
Lecithin	3,000
PEG-20 Sorbitan Isostearat	4,000
Glycerin	5,000
Dicaprylyl Ether	5,000
Konservierung	q.s.
Wasser	ad
	100,000

Die Ölphase und die Wasserphase werden getrennt auf je 70 - 75° C erhitzt. Die Wasserphase wird zu der Ölphase getropft und es bildet sich ein Gel. Bei weiterem Zutropfen der Wasserphase und Abkühlen der Mischung entsteht eine O/W-Mikroemulsion.

WO 00/37042

PCT/EP99/10241

48

Beispiel 8

Hair-Tonic

	Gew.-%
Lecithin	3,000
Oleth-15	4,000
Glycerin	5,000
Dicaprylyl Ether	5,000
Konservierung	q.s.
Wasser	ad
	100,000

Die Ölphase und die Wasserphase werden getrennt auf je 70 - 75° C erhitzt. Die Wasserphase wird zu der Ölphase getropft und es bildet sich ein Gel. Bei weiterem Zutropfen der Wasserphase und Abkühlen der Mischung entsteht eine O/W-Mikroemulsion.

Beispiel 9

Body-Lotion

	Gew.-%
Lecithin	3,000
PEG-45 Palmkernöl Glycerides	4,000
Glycerin	5,000
Dicaprylyl Ether	5,000
Konservierung	q.s.
Wasser	ad
	100,000

Die Ölphase und die Wasserphase werden getrennt auf je 70 - 75° C erhitzt. Die Wasserphase wird zu der Ölphase getropft und es bildet sich ein Gel. Bei weiterem Zutropfen der Wasserphase und Abkühlen der Mischung entsteht eine O/W-Mikroemulsion.

Beispiel 10**Grundlage für Rasierschaum**

	Gew.-%
Lecithin	3,000
PEG-20 Sorbitan Monooleat	4,000
Glycerin	5,000
Dicaprylyl Ether	5,000
Konservierung	q.s.
Wasser	ad
	100,000

Die Ölphase und die Wasserphase werden getrennt auf je 70 - 75° C erhitzt. Die Wasserphase wird zu der Ölphase getropft und es bildet sich ein Gel. Bei weiterem Zutropfen der Wasserphase und Abkühlen der Mischung entsteht eine O/W-Mikroemulsion.

Beispiel 11**Aftershave-Lotion**

	Gew.-%
Lecithin	1,000
Polyglyceryl-10 Stearat	6,000
Glycerin	5,000
Dicaprylyl Ether	5,000
Konservierung	q.s.
Wasser	ad
	100,000

Die Ölphase und die Wasserphase werden getrennt auf je 70 - 75° C erhitzt. Die Wasserphase wird zu der Ölphase getropft und es bildet sich ein Gel. Bei weiterem Zutropfen der Wasserphase und Abkühlen der Mischung entsteht eine O/W-Mikroemulsion.

WO 00/37042

PCT/EP99/10241

50)

Beispiel 12**Gesichtsreinigungswasser**

	Gew.-%
Lecithin	2,000
Decaglycerylmonolaurat	5,000
Glycerin	5,000
Dicaprylyl Ether	5,000
Konservierung	q.s.
Wasser	ad
	100,000

Die Ölphase und die Wasserphase werden getrennt auf je 70 - 75° C erhitzt. Die Wasserphase wird zu der Ölphase getropft und es bildet sich ein Gel. Bei weiterem Zutropfen der Wasserphase und Abkühlen der Mischung entsteht eine O/W-Mikroemulsion.

Beispiel 13**Duschöl, wenig schäumend**

	Gew.-%
Lecithin	3,500
PEG-20 Glyceryl Laurat	3,500
Glycerin	5,000
Dicaprylyl Ether	5,000
Konservierung	q.s.
Wasser	ad
	100,000

Die Ölphase und die Wasserphase werden getrennt auf je 70 - 75° C erhitzt. Die Wasserphase wird zu der Ölphase getropft und es bildet sich ein Gel. Bei weiterem Zutropfen der Wasserphase und Abkühlen der Mischung entsteht eine O/W-Mikroemulsion.

WO 00/37042

PCT/EP99/10241

51

Beispiel 14

Pumpzerstäuber	Gew.-%
Lecithin	3,000
PEG-20 Monostearat	4,000
Glycerin	5,000
Dicaprylyl Ether	5,000
Konservierung	q.s.
Wasser	ad
	100,000

Die Ölphase und die Wasserphase werden getrennt auf je 70 - 75° C erhitzt. Die Wasserphase wird zu der Ölphase getropft und es bildet sich ein Gel. Bei weiterem Zutropfen der Wasserphase und Abkühlen der Mischung entsteht eine O/W-Mikroemulsion.

Beispiel 15

Transparente Reinigungsemulsion gegen
fettige Haut

	Gew.-%
Lecithin	3,000
PEG-20 Glyceryl Stearat	4,000
Glycerin	5,000
Dicaprylyl Ether	5,000
Konservierung	q.s.
Wasser	ad
	100,000

Die Ölphase und die Wasserphase werden getrennt auf je 70 - 75° C erhitzt. Die Wasserphase wird zu der Ölphase getropft und es bildet sich ein Gel. Bei weiterem Zutropfen der Wasserphase und Abkühlen der Mischung entsteht eine O/W-Mikroemulsion.

WO 00/37042

52

PCT/EP99/10241

Beispiel 16

Erfrischende Preshave-Lotion

Gew.-%

Lecithin	4,000
Ceteareth-12	3,000
Glycerin	5,000
Dicaprylyl Ether	5,000
Konservierung	q.s.
Wasser	ad
	100,000

Die Ölphase und die Wasserphase werden getrennt auf je 70 - 75° C erhitzt. Die Wasserphase wird zu der Ölphase getropft und es bildet sich ein Gel. Bei weiterem Zutropfen der Wasserphase und Abkühlen der Mischung entsteht eine O/W-Mikroemulsion.

Beispiel 17

Abschminklotion

Gew.-%

Lecithin	2,000
PEG-20 Sorbitan Isostearat	5,000
Glycerin	5,000
Octyl Dodecanol	5,000
Konservierung	q.s.
Wasser	ad
	100,000

Die Ölphase und die Wasserphase werden getrennt auf je 70 - 75° C erhitzt. Die Wasserphase wird zu der Ölphase getropft und es bildet sich ein Gel. Bei weiterem Zutropfen der Wasserphase und Abkühlen der Mischung entsteht eine O/W-Mikroemulsion.

WO 00/37042

53

PCT/EP99/10241

Beispiel 18

Grundlage zur Solubilisierung von Parfüm-Riechstoffen (Parfüm-Zerstäuber)

	Gew.-%
Lecithin	2,000
PEG-20 Sorbitan Isostearat	5,000
Glycerin	5,000
Cetearyl Isononanoat	5,000
Konservierung	q.s.
Wasser	ad
	100,000

Die Ölphase und die Wasserphase werden getrennt auf je 70 - 75° C erhitzt. Die Wasserphase wird zu der Ölphase getropft und es bildet sich ein Gel. Bei weiterem Zutropfen der Wasserphase und Abkühlen der Mischung entsteht eine O/W-Mikroemulsion.

Beispiel 19

Grundlage zur Behandlung der Kopfhaut

	Gew.-%
Lecithin	2,000
PEG-20 Sorbitan Isostearat	5,000
Glycerin	5,000
Dioctylcyclohexan	5,000
Konservierung	q.s.
Wasser	ad
	100,000

Die Ölphase und die Wasserphase werden getrennt auf je 70 - 75° C erhitzt. Die Wasserphase wird zu der Ölphase getropft und es bildet sich ein Gel. Bei weiterem Zutropfen der Wasserphase und Abkühlen der Mischung entsteht eine O/W-Mikroemulsion.

WO 00/37042

PCT/EP99/10241

54

Beispiel 20

	Gew.-%
Lecithin	1,000
Polyglyceryl-10 Stearate	6,000
Glycerin	5,000
Diethylcyclohexan	5,000
Konservierung	q.s.
Wasser	ad
	100,000

Die Ölphase und die Wasserphase werden getrennt auf je 70 - 75° C erhitzt. Die Wasserphase wird zu der Ölphase getropft und es bildet sich ein Gel. Bei weiterem Zutropfen der Wasserphase und Abkühlen der Mischung entsteht eine O/W-Mikroemulsion.

Beispiel 21

Deo/AT-Pumpzerstäuber

	Gew.-%
Lecithin	1,000
PEG-20 Sorbitan Isostearat	2.500
Glycerin	5,000
Octyl Dodecanol	2.500
Aluminium Chlorhydrate	5.000
Konservierung	q.s.
Wasser	ad
	100,000

Die Ölphase und die Wasserphase werden getrennt auf je 70 - 75° C erhitzt. Die Wasserphase wird zu der Ölphase getropft und es bildet sich ein Gel. Bei weiterem Zutropfen der Wasserphase und Abkühlen der Mischung entsteht eine O/W-Mikroemulsion:

WO 00/37042

55

PCT/EP99/10241

Beispiel 22

	Gew.-%
Lecithin	2,000
Oleth-15	5,000
Glycerin	5,000
Caprylic/Capric Triglycerides	5,000
Konservierung	q.s.
Wasser	ad
	100,000

Die Ölphase und die Wasserphase werden getrennt auf je 70 - 75° C erhitzt. Die Wasserphase wird zu der Ölphase getropft und es bildet sich ein Gel. Bei weiterem Zutropfen der Wasserphase und Abkühlen der Mischung entsteht eine O/W-Mikroemulsion.

Beispiel 23

	Gew.-%
Lecithin	3,000
PEG-45 Palmkernöl Glycerides	4,000
Glycerin	5,000
Diethylcyclohexan	5,000
Konservierung	q.s.
Wasser	ad
	100,000

Die Ölphase und die Wasserphase werden getrennt auf je 70 - 75° C erhitzt. Die Wasserphase wird zu der Ölphase getropft und es bildet sich ein Gel. Bei weiterem Zutropfen der Wasserphase und Abkühlen der Mischung entsteht eine O/W-Mikroemulsion.

WO 00/37042

PCT/EP99/10241

56

Beispiel 24

	Gew.-%
Lecithin	3,000
PEG-45 Palmkernöl Glycerides	4,000
Glycerin	5,000
Cetearyl Isononanoat	5,000
Konservierung	q.s.
Wasser	ad
	100,000

Die Ölphase und die Wasserphase werden getrennt auf je 70 - 75° C erhitzt. Die Wasserphase wird zu der Ölphase getropft und es bildet sich ein Gel. Bei weiterem Zutropfen der Wasserphase und Abkühlen der Mischung entsteht eine O/W-Mikroemulsion.

Beispiel 25

	Gew.-%
Lecithin	2,000
PEG-20 Sorbitan Monooleat	5,000
Glycerin	5,000
Octyl Dodecanol	5,000
Konservierung	q.s.
Wasser	ad
	100,000

Die Ölphase und die Wasserphase werden getrennt auf je 70 - 75° C erhitzt. Die Wasserphase wird zu der Ölphase getropft und es bildet sich ein Gel. Bei weiterem Zutropfen der Wasserphase und Abkühlen der Mischung entsteht eine O/W-Mikroemulsion.

WO 00/37042

PCT/EP99/10241

57

Beispiel 26

	Gew.-%
Lecithin	2,000
PEG-20 Sorbitan Monooleat	5,000
Glycerin	5,000
Caprylic/Capric Triglycerides	5,000
Konservierung	q.s.
Wasser	ad
	100,000

Die Ölphase und die Wasserphase werden getrennt auf je 70 - 75° C erhitzt. Die Wasserphase wird zu der Ölphase getropft und es bildet sich ein Gel. Bei weiterem Zutropfen der Wasserphase und Abkühlen der Mischung entsteht eine O/W-Mikroemulsion.

Beispiel 27

	Gew.-%
Lecithin	2,000
PEG-20 Sorbitan Monooleat	5,000
Glycerin	5,000
Cetearyl Isononanoat	5,000
Konservierung	q.s.
Wasser	ad
	100,000

Die Ölphase und die Wasserphase werden getrennt auf je 70 - 75° C erhitzt. Die Wasserphase wird zu der Ölphase getropft und es bildet sich ein Gel. Bei weiterem Zutropfen der Wasserphase und Abkühlen der Mischung entsteht eine O/W-Mikroemulsion.

WO 00/37042

58

PCT/EP99/10241

Beispiel 28

Duschöl

	Gew.-%
L cithin	0,250
Laurylethersulfat (25%)	40,000
Glycerylmonolinoleat	0,250
Glycerin	5,000
Dicaprylylether	3,000
Natriumchlorid	7,500
Wasser	ad
	100,000

Die Ölphase und ein Teil der Wasserphase werden getrennt auf je 70 - 75° C erhitzt. Die Wasserphase wird zu der Ölphase getropft und es bildet sich ein Gel. Bei weiterem Zutropfen der Wasserphase und Abkühlen der Mischung entsteht eine O/W-Mikroemulsion.

Beispiel 29

Gesichtreinigungsgel

	Gew.-%
Lecithin	6.660
PEG-50 Hydrogenated Castor Oil Isostearat	19.260
Glycerin	18.520
Dicaprylyl Ether	18.520
Wasser	37.040

Die Ölphase und die Wasserphase werden getrennt auf je 70 - 75° C erhitzt. Die Wasserphase wird zu der Ölphase getropft und es bildet sich ein Gel.

WO 00/37042

59

PCT/EP99/10241

Beispiel 30**G sichreinigungsgel**

	Gew.-%
Lecithin	6.660
PEG-50 Hydrogenated Castor Oil Isostearat	19.260
Glycerin	18.520
Dicaprylyl Ether	18.520
Wasser	37.040

Die Ölphase und die Wasserphase werden getrennt auf je 70 - 75° C erhitzt. Die Wasserphase wird zu der Ölphase getropft und es bildet sich ein Gel.

Beispiel 31**Augenmakeup-Entferner-Gel**

	Gew.-%
Lecithin	3.700
P lyglyceryl-10 Stearate	22.200
Glycerin	18.500
Dioctylcyclohexan	18.500
Wasser	37.010

Die Ölphase und die Wasserphase werden getrennt auf je 70 - 75° C erhitzt. Die Wasserphase wird zu der Ölphase getropft und es bildet sich ein Gel.

WO 00/37042

PCT/EP99/10241

60

Beispiel 32

Haargel

	Gew.-%
Lecithin	11.100
PEG-20 Sorbitan Isostearat	14.800
Glycerin	18.500
Dicaprylyl Ether	18.500
Wasser	37.100

Die Ölphase und die Wasserphase werden getrennt auf je 70 - 75° C erhitzt. Die Wasserphase wird zu der Ölphase getropft und es bildet sich ein Gel.

Beispiel 33

Duschgel

	Gew.-%
Lecithin	0.870
Laurylethersulfat (25%)	69.600
Glycerin	8.600
Dicaprylylether	8.700
Natriumchlorid	12.230

Die Ölphase und die Wasserphase werden getrennt auf je 70 - 75° C erhitzt. Die Wasserphase wird zu der Ölphase getropft und es bildet sich ein Gel.

WO 00/37042

61

PCT/EP99/10241

Beispiel 34

Gel

	Gew.-%
Lecithin	2.000
Polyglycerin-10 Stearat	24.000
Glycerinisostearate	2.000
Glycerin	20.000
Di ctylcyclohexan	20.000
Wasser	32.000

WO 00/37042

PCT/EP99/10241

62

Patentansprüche:

1. Gele oder niedrigviskose transparente oder transluzente Mikroemulsionen vom Typ Öl-in-Wasser, umfassend eine Wasserphase und eine Ölphase, welche im wesentlichen aus schwerflüchtigen Bestandteilen zusammengesetzt sind, enthaltend: Mindestens ein Phospholipid und mindestens einen Öl-in-Wasser Emulgator und gegebenenfalls mindestens einen W/O-Emulgator, erhältlich auf die Weise, daß die Wasserphase mit ihren Bestandteilen zu der Ölphase mit ihren Bestandteilen, insbesondere dem Phospholipid und dem O/W-Emulgator und gegebenenfalls W/O-Emulgator gegeben wird, wobei die Phasen miteinander vermischt werden und ein Gelzustand erhalten wird, und wenn eine niedrigviskose O/W-Mikroemulsion gewünscht wird, weitere Teile der Wasserphase zugegeben werden und die Phasen vermischt werden, wobei die Phasen gewünschtenfalls weitere Hilfs-, Zusatz- und/oder Wirkstoffe enthalten können.
2. Verfahren zur Herstellung von Gelen oder niedrigviskosen transparenten oder transluzenten Mikroemulsionen vom Typ Öl-in-Wasser, umfassend eine Wasserphase und eine Ölphase, welche im wesentlichen aus schwerflüchtigen Bestandteilen zusammengesetzt ist, enthaltend mindestens ein Phospholipid und mindestens einen Öl-in-Wasser Emulgator und gegebenenfalls mindestens einen W/O-Emulgator, dadurch gekennzeichnet, daß ein Phospholipid in der Ölphase, gegebenenfalls mit weiteren Bestandteilen, gelöst wird und die Wasserphase, gegebenenfalls mit weiteren Bestandteilen, dazugegeben wird und die Phasen vermischt werden, wobei sich ein Viskositätsanstieg ergibt und z.B. die Gele erhalten werden, und sich bei weiterer Zugabe der Wasserphase die Mikroemulsionen ergeben, wobei der Öl-in-Wasser Emulgator und gegebenenfalls der W/O-Emulgator der Ölphase zugesetzt werden können oder im Stadium der Gelbildung oder auch nach der Herstellung der Gele zugegeben werden können.
3. Gele gemäß Anspruch 1 oder 2, dadurch gekennzeichnet, daß sie als Haargel, Duschgel oder Hautgel verwendet werden.
4. Gele oder Mikroemulsionen gemäß Anspruch 1 oder 2, dadurch gekennzeichnet, daß sie Desodorantien oder Antitranspirantien enthalten.

WO 00/37042

PCT/EP99/10241

63

5. Gele oder Mikroemulsionen gemäß Anspruch 1 oder 2, dadurch gekennzeichnet, daß sie eine UVA- und/oder UVB-Filtersubstanz enthalten.
6. Gele oder Mikroemulsionen gemäß Anspruch 1 oder 2, dadurch gekennzeichnet, daß sie Antioxidantien enthalten.
7. Gele oder Mikroemulsionen gemäß Anspruch 1 oder 2, dadurch gekennzeichnet, daß sie als kosmetische Reinigungszubereitungen verwendet werden.
8. Gele oder Mikroemulsionen gemäß Anspruch 1 oder 2, dadurch gekennzeichnet, daß sie zur Haarpflege verwendet werden.
9. Gele oder Mikroemulsionen gemäß Anspruch 1 oder 2, dadurch gekennzeichnet, daß sie Wirkstoffe, Zusatzstoffe oder Hilfsstoffe enthalten.

Description

**Cosmetic or pharmaceutical lecithin-containing gels or low-viscosity
lecithin-containing O/W microemulsions**

5

The present invention relates to phospholipid-containing gels or microemulsions of the oil-in-water type, to processes for their preparation and to their use for cosmetic or pharmaceutical purposes. In particular, they are applied topically.

10

Cosmetic skincare is primarily to be understood as meaning that the natural function of the skin as a barrier against environmental influences (e.g. dirt, chemicals, microorganisms) and against the loss of endogenous substances (e.g. water, natural fats, electrolytes) is strengthened or

15

restored.

If this function is impaired, increased resorption of toxic or allergenic substances or attack by microorganisms may result, leading to toxic or allergic skin reactions.

20

Another aim of skincare is to compensate for the loss by the skin of lipids and water caused by daily washing. This is particularly important if the natural regeneration ability is inadequate. Furthermore, skincare products should protect against environmental influences, in particular against sun

25

and wind, and delay skin aging.

Medicinal compositions generally comprise one or more medicaments in an effective concentration. For the sake of simplicity, in order to differentiate clearly between cosmetic and medicinal use and

30

corresponding products, reference is made to the legal provisions of the Federal Republic of Germany (e.g. Cosmetics Directive, Foods and Drugs Act).

35

Cosmetic or dermatological preparations are frequently in the form of finely dispersed multiphase systems in which one or more fat or oil phases are present in addition to one or more water phases. Of these systems, in turn, the actual emulsions are the most widespread.

In simple emulsions, finely disperse droplets of one phase (water droplets in W/O emulsions or lipid vesicles in O/W emulsions), surrounded by an emulsifier shell, are present in a second phase. The droplet diameters of customary emulsions are in the range from about 1 μm to about 50 μm .

5 Such "macroemulsions" are, without further coloring additives, milky white in color and opaque. Finer "macroemulsions", whose droplet diameters are in the range from about 10^{-1} μm to about 1 μm are, again without coloring additives, bluish white in color and nontransparent.

10 Only micellar and molecular solutions having particle diameters of less than about 10^{-2} μm appear clear and transparent.

By contrast, the droplet diameters of transparent or translucent microemulsions are in the range from about 10^{-2} μm to about 10^{-1} μm .

15 Such microemulsions are mostly low-viscosity. The viscosity of many microemulsions of the O/W type is comparable with that of water.

An advantage of microemulsions is that active ingredients can be present in more finely disperse form in the disperse phase than in the disperse phase of "macroemulsions". A further advantage is that they are sprayable as a result of the low viscosity. If microemulsions are used as cosmetics, corresponding products are characterized by high cosmetic elegance.

20 A disadvantage of the microemulsions of the prior art is that a high content of one or more emulsifiers must always be used since the low droplet size brings about a large interface between the phases, which usually has to be stabilized by emulsifiers.

30 The use of customary cosmetic emulsifiers is in itself safe. Nevertheless, emulsifiers, like ultimately any chemical substance, may in individual cases cause allergic reactions or reactions based on user hypersensitivity.

For example, it is known that certain photodermatoses are triggered by said emulsifiers, but also by various fats, and simultaneous exposure to sunlight. Such photodermatoses are also called "Mallorca acne". One object of the present invention was therefore to develop sunscreen products.

Thus, the present invention relates, as a particular embodiment, to cosmetic and dermatological light protection preparations, in particular skincare cosmetic and dermatological light protection preparations.

5 The harmful effects of the ultraviolet part of solar radiation on the skin is generally known. While rays having a wavelength of less than 290 nm (the UVC region) are absorbed by the ozone layer in the earth's atmosphere, rays in the range between 290 nm and 320 nm, the UVB region, cause erythema, simple sunburn or even more or less serious burns.

10

The erythema activity maximum of sunlight is stated as the relatively narrow range around 308 nm.

15

Numerous compounds are known for protecting against UVB radiation; these are mostly derivatives of 3-benzylidene camphor, of 4-aminobenzoic acid, of cinnamic acid, or salicylic acid, of benzophenone and also of 2-phenylbenzimidazol.

20

For the range between about 320 nm and about 400 nm, the UVA region, it is also important to have available filter substances since rays of that region can also cause damage. For example, it has been proven that UVA radiation leads to damage of the elastic and collagenous fibers of connective tissue, causing premature aging of the skin, and that it is to be regarded as a cause of numerous phototoxic and photoallergic reactions.

25

The harmful effect of UVB radiation can be intensified by UVA radiation.

30

UV radiation can, however, also lead to photochemical reactions, in which case the photochemical reaction products then intervene in the skin's metabolism.

35

In order to prevent these reactions, antioxidants and/or free-radical scavengers can additionally be incorporated into the cosmetic or dermatological formulations.

35

Most of the inorganic pigments which are known for use in cosmetics for protecting the skin against UV rays are UV absorbers or UV reflectors. These pigments are oxides of titanium, zinc, iron, zirconium, silicon, manganese, aluminum, cerium and mixtures thereof, and also modifications.

Because of their good sprayability, microemulsions are also suitable for other cosmetic [lacuna] dermatological applications, for example deodorants, meaning that the present invention relates, in a particular embodiment, to microemulsions as a basis for cosmetic deodorants.

5

Cosmetic deodorants serve to eliminate body odor which arises when fresh perspiration, which is in itself odorless, is decomposed by microorganisms. Customary cosmetic deodorants are based on different active principles.

- 10 In antiperspirants, the formation of perspiration can be reduced by astringents - chiefly aluminum salts such as aluminum hydroxychloride (aluminum chlorhydrate).

- 15 By using antimicrobial substances in cosmetic deodorants it is possible to reduce the bacterial flora on the skin. In an ideal case, only the odor-causing microorganisms would be effectively reduced. The flow of perspiration itself is not influenced by this, and in an ideal case only microbial decomposition of the perspiration is temporarily stopped.

- 20 The combination of astringents with antimicrobial substances in one and the same composition is also customary.

Deodorants should satisfy the following conditions:

- 1) They should effect reliable deodorization.
25 2) The natural biological processes of the skin must not be impaired by the deodorant.
3) The deodorant must be harmless in the event of an overdose or other use which is not as specified.
4) They should not become concentrated on the skin following
30 repeated application.
5) They should be easy to incorporate into customary cosmetic formulations.

- 35 Liquid deodorants, for example aerosol sprays, roll-ons and the like, and also solid preparations, for example deodorant sticks, powders, powder sprays, intimate cleansing compositions etc. are known and customary.

The use of microemulsions as a base for deodorizing or antiperspirant preparations are also known. Their relatively high content of emulsifiers,

together with the described disadvantages, has hitherto been a shortcoming which has been in need of remedying.

5 A further object of the present invention was therefore to develop preparations which are suitable as bases for cosmetic deodorants or antiperspirants and do not have the disadvantages of the prior art.

It was also an object of the invention to develop cosmetic bases for cosmetic deodorants which are characterized by good skin compatibility.

10

In addition it was an object of the present invention to make available products based on microemulsions having the broadest possible application diversity. For example, bases for preparation forms such as cleansing emulsions, face- and bodycare preparations were to be provided, but also decidedly medicinal-pharmaceutical administration forms, for example preparations against acne and other skin phenomena.

15

In a particular embodiment, the invention therefore relates to cleansing emulsions, in particular face cleansing emulsions, preferably make-up removers, for example eye make-up removers.

20

Such preparations are known per se. They are usually mixtures of cosmetic oils or aqueous preparations of surface-active substances, the function of which is to solubilize the foreign substance or the make-up substance and remove it from the skin.

25

Water resistant eye make-up, for example, mascara, can only be removed satisfactorily with aqueous-based make-up removers containing specific surfactants. However, the surfactants often only have limited physiological compatibility. When such substances come into contact with the mucous membrane, in particular the mucous membrane of the eye, they lead to irritations which manifest themselves, for example, in a reddening of the eyes. Reactions of this type are typical of surfactant-containing products.

30

35 An object of the present invention was therefore to remedy such problems.

The present invention relates in a further embodiment to hair cosmetic preparations. In particular, the present invention relates to hair cosmetic preparations for the care of hair and the scalp. In a preferred embodiment,

the present invention relates to preparations which serve to strengthen individual hairs and/or impart hold and body to the hairstyle overall.

5 Roughly speaking, human hair can be divided into the living part, the hair root, and the dead part, the hair shaft. The hair shaft in turn comprises the medulla which, however, as a result of evolution, has become insignificant for modern man and has receded, and in cases of thin hair, is often absent entirely, and also the cortex surrounding the medulla and the cuticula which encloses the totality of medulla and cortex.

10 The cuticula in particular, but also the keratinous region between the cuticula and cortex, as the outer sheath of the hair, are exposed to particular demands as a result of environmental influences, as a result of combing and brushing, but also as a result of hair treatment, in particular
15 the coloring and shaping of hair, e.g. permanent waving processes.

If the stress is particularly aggressive, for example bleaching with oxidizing agents such as hydrogen peroxide, in which the pigment distributed within the cortex are destroyed by oxidation, the inside of the hair can also be
20 affected. If human hair is to be colored permanently, in practice only oxidizing hair coloring processes are suitable. During the oxidative coloring of hair, the dye chromophors are formed as a result of the reaction of precursors (phenols, aminophenols, and less frequently also diamines) and bases (in most cases p-phenylenediamine) with the oxidizing agent, in
25 most cases hydrogen peroxide. Hydrogen peroxide concentrations of about 6% are usually used for this.

It is usually assumed that in addition to the coloring action, a bleaching action also takes place as a result of the hydrogen peroxide. In oxidatively
30 colored human hair, as in the case of bleached hair, microscopic holes are detectable at the points where melanin granules were present. The fact is that the oxidizing agent hydrogen peroxide can react not only with the dye precursors, but also with the hair substance and as a result cause damage to the hair under certain circumstances.

35 Washing the hair with aggressive surfactants can also stress the hair, and at least reduce its appearance or the appearance of the hairstyle overall. For example, certain water-soluble constituents of hair (e.g. urea, uric acid,

xanthine, keratin, glycogen, citric acid and lactic acid) can be leached out as a result of hair washing.

For these reasons, some haircare cosmetics which are intended to be
5 rinsed out of the hair again once they have acted, and some of those
which remain on the hair have been used for a relatively long time. The
latter can be formulated such that they not only serve to care for the
individual hairs, but also improve the appearance of the hairstyle overall,
for example by imparting more body to the hair, fixing the hairstyle over a
10 relatively long period or improving its ease of styling.

By using quaternary ammonium compounds, for example, the combability
of the hair can be decisively improved. Such compounds attach to the hair
and are often still detectable on the hair after the hair has been washed a
15 number of times.

However, the prior art has lacked active ingredients and preparations
which satisfactorily care for damaged hair. Preparations which are
intended to give body to the hairstyle have also often proven to be
20 inadequate, or they were at least unsuitable for use as haircare
preparations. The preparations of the prior art which fix the hairstyle
generally comprise, for example, viscous constituents which run the risk of
giving rise to a feeling of tackiness, which often has to be compensated for
by skillful formulation.

25 An object was therefore also to overcome these the disadvantages of the
prior art.

Finally, it was also the aim to in principle open up the way for emulsions
30 which can be used internally, for example for the parental administration of
pharmaceutical active ingredients and for parental feeding by the present
invention.

A particular object of the present invention was to make available finely
35 disperse preparations of the oil-in-water type with the lowest possible
emulsifier content which do not have the disadvantages of the prior art and
which can be used for a very wide variety of cosmetic and/or
dermatological applications, for example the uses described above. A

further object of the invention was to enrich the limited range of finely disperse preparations of the oil-in-water type of the prior art.

5 It is known per se that hydrophilic emulsifiers, namely polyethoxylated and polypropoxylated emulsifiers, change their solubility behavior from water-soluble to fat-soluble with increasing temperature. An indicator of the hydrophilicity of a given emulsifier is its HLB value.

10 The definition of the HLB value is given, for polyol fatty acid esters, by the relationship

$$\text{HLB} = 20 \cdot (1 - S/A) \quad (\text{formula I})$$

For a group of emulsifiers whose hydrophilic fraction consists only of ethylene oxide units, the following relationship applies

15

$$\text{HLB} = E/5 \quad (\text{formula II})$$

where S = saponification number of the ester,
 A = acid number of the recovered acid
20 E = mass fraction of ethylene oxide (in %) of the overall molecule.

Emulsifiers with HLB values of 6-8 are generally W/O emulsifiers, and those with HLB values of 8-18 are generally O/W emulsifiers.

25 Literature: "Kosmetik - Entwicklung, Herstellung und Anwendung kosmetischer Mittel" [Cosmetics - development, preparation and use of cosmetic compositions]; W. Umbach (Ed.), Georg Thieme Verlag 1988.

30 The temperature range within which the emulsifiers change their solubility is referred to as the phase inversion temperature range. Within this specification, the abbreviation "PIT" will also be used for the phase inversion temperature range.

35 The change in this solubility behavior is evident, as is known, from the fact that a mixture of water, oil and O/W emulsifiers which produces an O/W emulsion below the PIT after stirring, is brought to a temperature above the PIT, typically about 70-90°C, can pass through the state of a microemulsion as intermediate stage in order finally to give a W/O

emulsion above the PIT. If this emulsion is cooled, an O/W emulsion is again obtained, although it has a droplet size of up to 200 nm and is in the range between a microemulsion and a fine macroemulsion.

- 5 However, microemulsions of the prior art prepared in this way have the disadvantage that firstly the droplet size is still very high, and the emulsion is opaque white bluish at room temperature and/or a high content of one or more emulsifiers is still necessary.
- 10 It is also disadvantageous that although microemulsions prepared in this way can be virtually transparent at high temperature, i.e. for example in the PIT, they become nontransparent again when the temperature is reduced to room temperature.
- 15 It was therefore also the aim to remedy these shortcomings.

It was a particular object of the present invention to make available low-viscosity preparations based on finely disperse systems of the oil-in-water type having the lowest possible emulsifier content which do not have the disadvantages of the prior art and which can be used for a very wide variety of cosmetic and/or dermatological applications, for example the uses described above. It was a further object of the invention to enrich the limited range of low-viscosity preparations based on finely disperse lecithin-containing systems of the oil-in-water type of the prior art.

- 25 Lecithin-containing microemulsions for cosmetic, pharmaceutical, parenteral applications are known from the literature. Droplet sizes below 100 nm are achieved by high-pressure homogenization of corresponding macroemulsions. A disadvantage is that high shear forces on the droplets arise and metal abrasion takes place, which can only be removed from the corresponding administration forms with difficulty. In addition, ultrasound can also be used to prepare corresponding microemulsions. It is disadvantageous that these processes are expensive due to the high input of energy.
- 30 Sometimes it is disadvantageous in the case of known O/W microemulsions which do not contain phospholipids that they do not always have entirely satisfactory care effects (skin moisturizing, skin roughness reduction, skin flakiness reduction).
- 35

In addition, microemulsions containing lecithin are obtained in the presence of high concentrations of short-chain alcohols, alkanediols, amines, which are unsuitable for cosmetic, pharmaceutical and parenteral applications.

5

High-pressure homogenization or ultrasound for the preparation of parenteral emulsions, for cosmetic or pharmaceutical applications are described in the literature.

10 Int. J. Pharm. 163, 1998, 81; J. Pharm. Belg. 52, 1997, 110; J. Pharm. Sci. 82, 1993, 1069; J. Pharm. Sci. 83, 1994, 72; Parf. and Kosmet. 10, 1994, 652; 3, 1995, 152; Pharm. Res. 12, 1995, 1273; SÖFW 9, 1994, 530.

15 Phospholipid O/W microemulsions with cosolvents such as short-chain alcohols (propanol, butanol, ethanol, isopropanol, sec-butanol, tert-butanol, n-pentanol); alkanediols, short-chain alkyl ethers or amines are described in the literature.

20 Int. J. Pharm. 125, 1995, 107; Int. J. Pharm. 111, 1994, 63; Int. J. Pharm. 161, 1993, 161; Int. J. Pharm. 106, 1994, 51; Int. J. Pharm. 116, 1995, 253; Int. J. Pharm. 84, 1992, R5-R8; J. Phys. Chem. 95, 1991, 989, Langmuir 14, 1998, 3506; Langmuir 11, 1995, 1576; SÖFW 124, 1998, 614-623.

Phospholipid O/W microemulsions containing interface-active pharmaceuticals are described in the literature.

25 Int. J. Pharm. 125, 1995, 231; Int. J. Pharm. 89, 1993, R9-R12.

30 Low-viscosity microemulsions for oral applications based on lecithin/ethanol/propylene glycol are described in WO 92/02207. Also described therein is the thickening to give the microemulsion gel using gelatin as water-soluble polymer. A disadvantage of cosmetic applications is the lack of a cosmetic oil phase.

35 The use of ethanol as amphiphilic cosolvent for the preparation of lecithin-containing microemulsions and also the gelling with polysaccharides such as gelatin or agar is also described in WO 95/31969.

Lecithin-containing transparent oil-in-water emulsions thickened with gelatin are also described in FR 2618351. The transparency is achieved by matching the reflective indexes of water and oil phase. Accordingly, no microemulsion is present here.

EP 406162 B1 describes a process for the preparation of a nanoemulsion with triglycerides or fatty acid esters. On p. 2, ll. 36-43 and on p. 3 ll. 18-28, it is emphasized that the lecithin emulsifier should have a lamellar liquid crystalline structure, which is then processed with a high-pressure homogenizer to give the nanoemulsion.

DE 3930928 C2 describes pharmaceutical formulations containing cyclosporin. The microemulsion concentrate used is, in addition to cyclosporin as active ingredient, advantageously propylene glycol or glycofurol as hydrophilic component. On page 6 lines 7 to 12, it is stated that these concentrates represent O/W or W/O macroemulsions. The gel state which is advantageously passed through, which is not to be regarded as a macroemulsion, is not mentioned. In the examples, essentially ethoxylated emulsifiers are used, and lecithin-containing formulations and the procedure in the preparation of the invention forming the basis of this application are not mentioned apart from ex. 1.4. In addition, short-chain ethers such as transcitol and glycofurol are not very suitable for cosmetic purposes due to penetration.

EP 0100448 and DE 3225706 describe phospholipid-containing microemulsions consisting of an ethoxylated glycerol ester, phospholipid and an oil phase. The oil phase used is isopropyl palmitate, glyceryl triacetate or Miglyols. The lipophilic phase is mixed with phospholipid and O/W emulsifier and then diluted with water. A gel state is not passed through here as an intermediate stage. The short-chain alcohol used is ethanol or isopropanol. These ingredients are known as penetration accelerators and are therefore disadvantageous.

EP 760237 describes pharmaceutical preconcentrates which consist of mono-, di-, triglycerides as oil phase, pharmaceutical active ingredient and a phospholipid and one other emulsifier. Dilution of the concentrate in water produces O/W microemulsions. In particular, the formulations prepared in this way should prevent the active ingredient cyclosporin from subsequently precipitating out. A disadvantage is that only coconut oil, castor oil or peanut oil are used as oil phases. An intermediate gel state is not passed through.

WO 9709964 describes mixtures of phospholipids and hydrophilic surfactants which, in addition to the oil phase, comprise a "surfactant film modifier". This is preferably ethanol or a C3-alcohol. On page 7, lines 1-4, it is stated that the mixtures used must be equilibrated for two to 3 days,

which may be regarded as a disadvantage. The oil phase used in the examples is only Miglyol 810 (short-chain triglyceride) and isopropyl myristate. The generation of the microemulsion via an intermediate gel state is not disclosed.

5 WO 97/30695 describes microemulsions for intravenous purposes.

In this respect, concentrates are firstly prepared which consist of phospholipids, propylene glycol (or PEG), an emulsifier with a high HLB value, an active ingredient and 0-30% of water. Oil components used are triglycerides or else propylene glycol diesters.

10 On page 6 lines 11-13 reference is made to the propylene glycol to be used particularly advantageously. This may also be partially or completely substituted by polyethylene glycol (p. 10, ll. 18-19). Alcohols such as ethanol are less suitable for intravenous purposes. On page 23 ll. 23-25 and page 24, ll. 4-5, it is stated how significant the propylene glycol is for
15 the manufacture of transparent preparations. Formulations without propylene glycol produce milky opaque emulsions following dilution with water. The advantage of a gel state is not recognized.

EP 852941 describes nanodispersions which are produced by dissolving the phospholipid in ethanol and subsequently admixing with an
20 unsaturated ethoxylated sorbitan ester and an active ingredient (or oil phase).

It is a disadvantage that ethanol has to be used, which may, in particular, lead to increased penetration into the skin and/or can partially or entirely cancel the positive properties of the phospholipids since ethanol has a
25 drying effect. In addition, only triglycerides are solubilized with the process presented above. It is a disadvantage that only sorbitan esters, in particular saturated ones, can be used, meaning that it is necessary to seek very effective antioxidants for product protection of the phospholipids (if unsaturated ones are to be used), which are in any case already to be
30 stabilized.

The same disadvantages arise in WO 96/37192, in which sphingo lipids and glycolipids are solubilized.

EP 956851 describes nanodispersions which can be prepared in two different ways. The first process relates to the mixing of a membrane-forming molecule (phospholipid), a coemulsifier (ethoxylated) and a
35 lipophilic constituent (oil phase or active ingredient), which are mixed until a homogeneous, clear solution forms (nanodispersion prephase). This prephase is introduced into a water phase without the input of energy (page 2, lines 35-50). On page 2, lines 51-52, it is stated that water is not

necessary for mixing the phospholipid/coemulsifier/oil phase mixture. The advantage of the addition of water and the thus induced formation of a gel state (i.e. the advantageous formation of a mesophase) has not been recognized. The second process differs from the first in that the prephase additionally comprises propylene glycol or ethanol. In the examples for the preparation of nanodispersions, only triglycerides are used as typical oil phase, which is disadvantageous. The addition of a lipophilic coemulsifier, which then permits dispensation of ethanol, is not described.

DE 3225706 describes liquid active ingredient formulations in the form of concentrates for microemulsions. It is described that, as well as making use of phospholipid, use is made of an O/W coemulsifier with a HLB value of 12-18. The gel state to be passed through according to the invention during the preparation of the microemulsion is not described. The broad variability of the use of different oil phases which arise through the use of a W/O emulsifier or through the use of O/W emulsifiers other than those described, and the advantageous combination of an O/W emulsifier and of a W/O emulsifier in addition to a phospholipid is not described. The disadvantages associated with the use of ethanol for microemulsions, such as skin drying, increased penetration, are not described.

DE 3302898 describes an emulsifying system which comprises a fatty acid or a protein condensate, a polyethoxylated stearyl and a phosphatide. On page 6, line 25 it is stated that emulsoids are understood as meaning emulsions whose particle size is less than one micron. It is known to the person skilled in the art that there are more finely divided emulsions (e.g. PIT emulsions), the particle size of which may be less than one micron. Neither is the gel formation described utilized for forming an O/W microemulsion.

WO 9405298 describes "submicron emulsions" for applications around the eye. The reduction of the particle size is achieved by homogenization of a coarsely particulate emulsion at a pressure of a 8000 psi and subsequent filtration (p. 14, ll. 18-24). It is a disadvantage that it is not possible here to dispense with high-pressure homogenization.

In addition, microemulsions with cationic ingredients are known which, as conditioning agents, facilitate the stylability of hair. A disadvantage here is the use of the cationic additives.

Lecithin organogels are described in the literature. Colloid Polymer Science 268, 1990, 356; Colloid J. 58, 1996, 117; Colloid Polym. Sci. 266, 1990, 356; Int. J. Pharm. 137, 1996, 117; J. Phys. Chem. 92, 1988, 829; J. Pharm Sci. 81, 1992, 871; J. Contr. Rel. 34, 1995, 53; Proced. Intern.

Symp. Control. Rel. Bioact. Mater. 17, 1990, 421; Progr. Colloid Polym. Sci. 105, 1997, 204; Progr. Colloid Polym. Sci. 106, 1997, 228; Skin. Pharmacol. 9, 1996, 124.

These emulsifier-free organogels are obtained by adding small amounts of water to a mixture of organic solvent and lecithin. Here, when water is added, the inverse micelles form cylinder-like water-filled micelles ("wormlike micelles"), which become entangled with one another and thus explain the high viscosity of these mixtures. (Colloid Polym. Sci. 268, 1990, 356).

- 5
- 10 Strictly speaking, these lecithin gels do not represent microemulsion gels since the dispersed phase is not in droplet form and also a corresponding viscosity-increasing substance for the continuous phase is missing. Neither is it described that these gels of the prior art can also be obtained in the presence of an O/W emulsifier. Neither is it described that these gels can
- 15 also be obtained in the presence of an O/W emulsifier or a W/O emulsifier. Neither is it described that the gels of the prior art can be converted in the presence of water into other colloidochemical phases, such as, for example, O/W microemulsions and O/W macroemulsions. Neither is it described that, in the presence of an O/W emulsifier, gel-like preparations
- 20 can be obtained which can be converted in a targeted manner into low-viscosity, lecithin-containing O/W microemulsions by dilution with water. It is not described that, in the presence of an O/W emulsifier or a W/O emulsifier, gel-like preparations can be obtained which can be converted in a targeted manner into low-viscosity, lecithin-containing O/W
- 25 microemulsions by dilution with water.

It was an object of the invention to avoid said disadvantages.

This object is achieved according to the invention.

30

- The invention provides gels or low-viscosity transparent or translucent microemulsions of the oil-in-water type, comprising a water phase and an oil phase, which are essentially composed of low-volatility constituents, comprising: at least one phospholipid and at least one oil-in-water emulsifier and optionally at least one W/O emulsifier, obtainable by adding
- 35 the water phase with its constituents to the oil phase with its constituents, in particular the phospholipid and the O/W emulsifier and optionally the W/O emulsifier, the phases being mixed with one another and a gel state being achieved, and if a low-viscosity O/W microemulsion is desired,

further parts of the water phase are added and the phases are mixed, it being possible, if desired, for the phases to comprise further auxiliaries, additives and/or active ingredients.

- 5 The invention also provides a process for the preparation of gels or low-viscosity transparent or translucent microemulsions of the oil-in-water type, comprising a water phase and an oil phase, which is essentially composed of low-volatility constituents, comprising at least one phospholipid and at least one oil-in-water emulsifier and optionally at least one W/O emulsifier, characterized in that a phospholipid is dissolved in the oil phase, optionally with further constituents, and the water phase, optionally with further constituents, is added thereto and the phases are mixed, during which the viscosity increases and, for example, the gels are obtained and, upon the further addition of the water phase, the microemulsions arise, where the oil-in-water emulsifier and optionally the W/O emulsifier can be added to the oil phase or can be added at the gel formation stage or else following preparation of the gels.

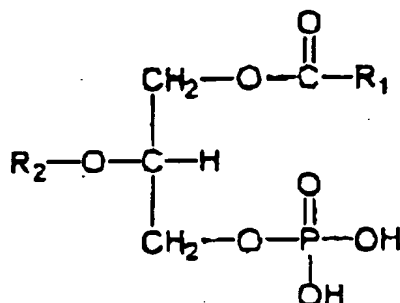
- 20 The water phase is expediently metered into or added dropwise to the oil phase, e.g. with stirring, until there is an increase in the viscosity or until a gel forms and then the remaining water phase is metered in. The lecithin is advantageously dissolved in the oil phase (optionally at elevated temperature). It is, however, also possible to dissolve the lecithin in the oil at room temperature. The O/W emulsifier and optionally the W/O emulsifier can be added directly to the oil phase or not until the stage of gel formation or following preparation of the lecithin organogel (phospholide/organic solvent). The water phase can be added at room temperature or optionally at elevated temperature.

- 30 The components are preferably mixed by stirring, optionally at elevated temperature. In particular, it is thus possible to dispense with an input of energy, e.g. by homogenization.

- 35 In the description, by "lecithin" are also meant, for example, the phospholipids, which include, for example, the following substances: phosphatidic acids, the real lecithins, cardiolipins, lysophospholipids, lysolecithins, plasmalogens, phosphosphingolipids, sphingomyelins. Preferred substances are described below.

Phosphatidic acids are glycerol derivatives which have been esterified in the 1-sn- and 2-position with fatty acids (1-sn-position: mostly saturated, 2-position: mostly mono- or polyunsaturated), but on atom 3-sn with phosphoric acid, and are characterized by the general structural formula

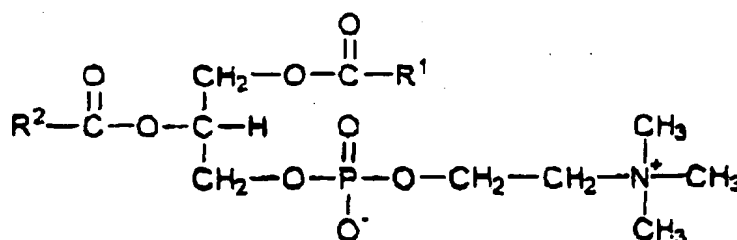
5



In the phosphatidic acids which occur in human or animal tissue, the phosphate radical is in most cases esterified with amino alcohols such as choline (lecithin = 3-sn-phosphatidylcholine) or 2-aminoethanol (ethanolamine) or L-serine (cephalin = 3-sn-phosphatidylethanolamine or sn-phosphatidyl-L-serine), with myoinositol to give the phosphoinositides [1-(3-sn-phosphatidyl)-D-myoinositols], common in tissues, with glycerol to give phosphatidyl glycerols. Particular preference is given to lecithins (=3-sn-phosphatidylcholine).

15

Lecithins (or the real lecithins) are characterized, for example, also by the general structural formula



20

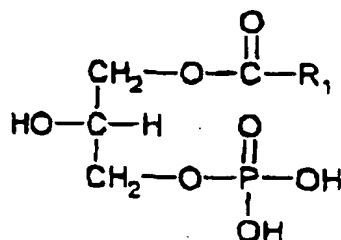
where R^1 and R^2 are typically unbranched aliphatic radicals having 15 or 17 carbon atoms and up to 4 cis double bonds.

25 Cardiolipins (1,3-bisphosphatidyl glycerols) are phospholipids of two phosphatidic acids linked via glycerol.

Lysophospholipids are obtained when an acyl radical is cleaved off by a phospholipase A from phospholipids (e.g. lysolecithins).

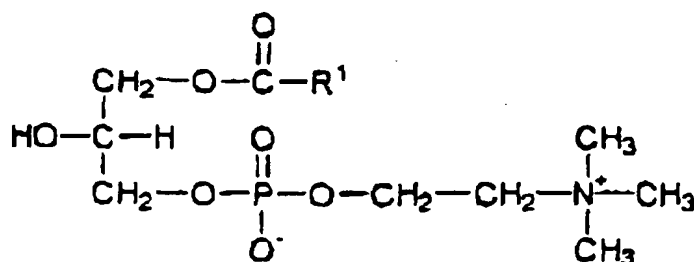
Lysophospholipids are characterized by the general structural formula

5



Lysolecithins, for example, are characterized by the general structural formula

10



where R and R² are typically unbranched aliphatic radicals having 15 or 17 carbon atoms and up to 4 cis double bonds.

15

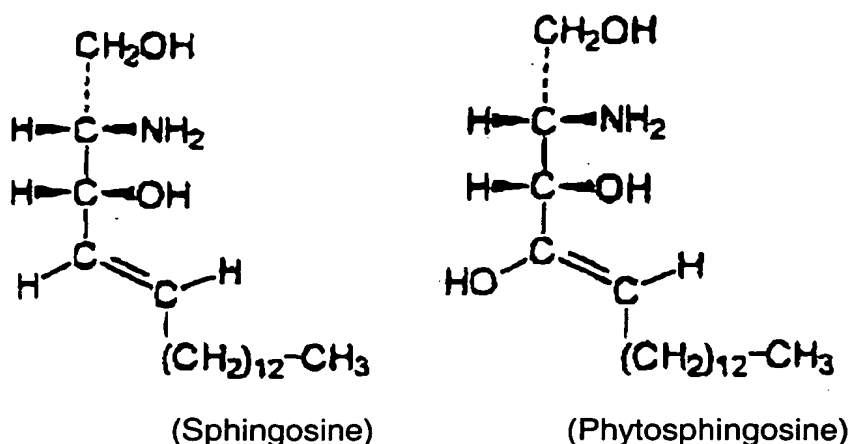
Preferred phospholipids are phosphatidylcholine, phosphatidylethanolamine, phosphatidylinositol or N-acylphosphatidylethanolamine or mixtures of two or more of these compounds.

20

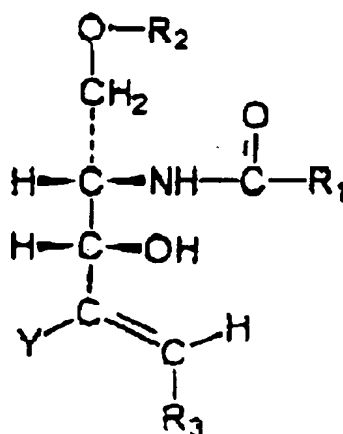
The phospholipids also include plasmalogens in which an aldehyde (in the form of an enol ether) is bonded in the 1-position instead of a fatty acid; the O-1-sn-alkenyl compounds corresponding to the phosphatidylcholines are called, for example, phosphatidylcholines.

25

Phosphosphingolipids are based on the basic structure of sphingosine or else phytosphingosine, which are characterized by the following structural formulae:

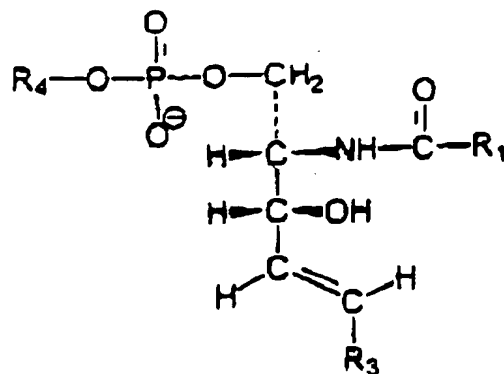


- 5 Modifications of sphingolipids are characterized, for example, by the (Sphingosine) (Phytosphingosine) general basic structure



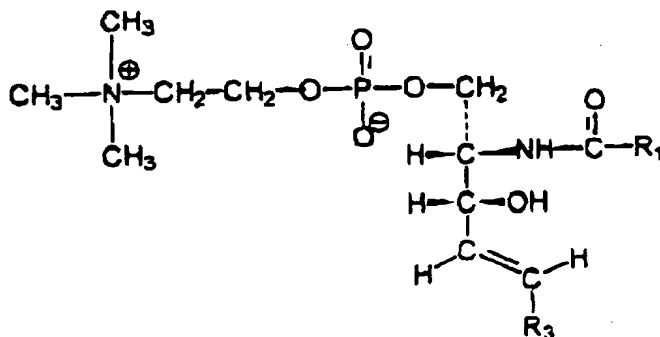
- 10 in which R_1 and R_3 , independently of one another, are saturated or unsaturated, branched or unbranched alkyl radicals having 1 to 28 carbon atoms, R_2 is chosen from the group: hydrogen atom, saturated or unsaturated, branched or unbranched alkyl radicals having 1 to 28 carbon atoms, sugar radicals, phosphate groups which are unesterified or
- 15 esterified with organic radicals, sulfate groups which are unesterified or esterified with organic radicals, and Y is either a hydrogen atom, a hydroxyl group or another heterofunctional radical.

Sphingophospholipids:



R_1 and R_3 are alkyl radicals, R_4 is an organyl radical.

- 5 Sphingomyelins are organophosphorylated sphingolipids of the type



- 10 Particularly preferred phospholipids are lecithins. Types of lecithin which are to be used advantageously are chosen from crude lecithins which have been deoiled and/or fractionated and/or spray-dried and/or acetylated and/or hydrolyzed and/or hydrogenated. They are available commercially. Preference is given to soybean lecithins.

- 15 Phospholipids which may be used advantageously according to the invention are, for example, available commercially under the trade names Phospholipon 25 (Nattermann), Emulmetik 120 (Lucas Meyer), Stempur E (Stern), Stempur PM (Stern), Nathin 3KE (Stern), Phospholipon 90 (Rhône-Poulenc), Phospholipon 90 H (Rhône-Poulenc).

20

In the presence of the O/W emulsifier it is possible for new types of gel to form in which other colloidochemical phases are also present, as in the "pure" lecithin organogels known in the literature such as, for example, lamellar liquid crystals, cubic phases, bicontinuous microemulsion gels,

O/W microemulsion gels, inverse hexagonal phases, hexagonal phases, inverse mycellar phases, WO microemulsion gels.

All of these e.g. creamy preparations characterized by an increase in viscosity are referred to here as "gels". If more water phase is added to the

5 gel, the viscosity decreases and a low-viscosity O/W microemulsion forms. The preferred intermediate gel formation according to the invention (i.e. the corresponding colloidchemical phase) and its targeted breakdown by dilution with water (i.e. the conversion of the colloidchemical phase into another) permits the preparation of finely divided O/W microemulsions. In

10 this way, it is possible for the first time to use a large number of O/W emulsifiers. In addition, the greater variability in the choice of O/W emulsifiers favors a greater variety of cosmetic oil phases. The addition of W/O emulsifiers is advantageous if stability problems arise or if active ingredients are difficult to solubilize. In addition, this makes it possible to

15 dispense with ethanol, meaning that the skin-drying or excessive penetration-promoting disadvantages of the administration system of the prior art are avoided.

In this way, it is possible to incorporate a greater number of active ingredients which differ, for example, by virtue of their polarity or their

20 hydrophilicity/lipophilicity more readily into O/W microemulsions.

Suitable O/W emulsifiers are described below.

Ethoxylated fatty acid esters and fatty acid glycerides, in particular

25 PEG-50 hydrogenated castor oil isostearate
PEG-45 palm kernel oil glycerides

polyglycerol esters, in particular

Polyglycerol-10 stearate

30 Polyglycerol-10 laurate

ethoxylated glycerol esters, in particular

PEG-20 glyceryl laurate

PEG-20 glyceryl stearate

35 fatty acid ethoxylates, in particular
PEG-20 monostearate

fatty alcohol ethoxylates, in particular

Ceteareth-12

Oleth-15

alkyl ether sulfates, ether carboxylates, in particular

5 Na lauryl ether sulfate

sulfated glycerol esters, in particular

Na glyceryl cocoyl sulfate, ammonium glyceryl cocoyl sulfate

10 acyl lactylates, acyl sarcosinates, acyl glutamates, in particular

Na lauroyl lactylate

sorbitan esters or derivatives thereof, e.g.

ethoxylated sorbitan esters, in particular

15 PEG-20 sorbitan isostearate

PEG-20 sorbitan monooleate can optionally also be used.

The O/W emulsifiers below are preferred.

20 Advantageously, the polyethoxylated or polypropoxylated or polyethoxylated and polypropoxylated O/W emulsifier or the polyethoxylated or polypropoxylated or polyethoxylated and polypropoxylated O/W emulsifiers are used which can be chosen from the group

- 25 - of fatty alcohol ethoxylates of the general formula $R-O-(CH_2-CH_2-O)_n-H$, where R is a branched or unbranched alkyl or alkenyl radical and n is a number from 10 to 50
- of ethoxylated wool wax alcohols,
- of polyethylene glycol ethers of the general formula $R-O-(CH_2-CH_2-O)_n-R'$, where R and R', independently of one another, are
- 30 branched or unbranched alkyl or alkenyl radicals and n is a number from 10 to 80
- of fatty acid ethoxylates of the general formula $R-COO-(CH_2-CH_2-O)_n-H$, where R is a branched or unbranched alkyl or alkenyl radical and n is a number from 10 to 40,
- 35 - of etherified fatty acid ethoxylates of the general formula $R-COO-(CH_2-CH_2-O)_n-R'$, where R and R', independently of one another, are branched or unbranched alkyl or alkenyl radicals and n is a number from 10 to 80,
- of esterified fatty acid ethoxylates of the general formula

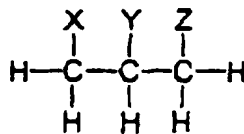
- R-COO-(-CH₂-CH₂-O-)_n-C(O)-R', where R and R', independently of one another, are branched or unbranched alkyl or alkenyl radicals and n is a number from 10 to 80,
- of polyethylene glycol glycerol fatty acid esters of saturated and/or unsaturated, branched and/or unbranched fatty acids and [lacuna] a degree of ethoxylation between 3 and 50,
 - of ethoxylated sorbitan esters having a degree of ethoxylation of from 3 to 100
 - of cholesterol ethoxylates having a degree of ethoxylation between 3 and 50,
 - of ethoxylated triglycerides having a degree of ethoxylation between 3 and 150,
 - of alkyl ether carboxylic acids of the general formula R-O-(-CH₂-CH₂-O-)_n-CH₂-COOH or cosmetically or pharmaceutically acceptable salts thereof, where R is a branched or unbranched alkyl or alkenyl radical having 5 - 30 carbon atoms and n is a number from 10 to 30,
 - of polyoxyethylene sorbitol fatty acid esters based on branched or unbranched alkanoic or alkenoic acids and having a degree of ethoxylation of from 5 to 100, for example of the Sorbeth type,
 - of alkyl ether sulfates or the acids on which these sulfates are based, of the general formula R-O-(-CH₂-CH₂-O-)_n-SO₃-H with cosmetically or pharmaceutically acceptable cations, where R is a branched or unbranched alkyl or alkenyl radical having 5 - 30 carbon atoms and n is a number from 1 to 50,
 - of fatty alcohol propoxylates of the general formula R-O-(-CH₂-CH(CH₃)-O-)_n-H, where R is a branched or unbranched alkyl or alkenyl radical and n is a number from 10 to 80,
 - of polypropylene glycol ethers of the general formula R-O-(-CH₂-CH(CH₃)-O-)_n-R', where R and R', independently of one another, are branched or unbranched alkyl or alkenyl radicals and n is a number from 10 to 80,
 - of propoxylated wool wax alcohols,
 - of etherified fatty acid propoxylates of the general formula R-COO-(-CH₂-CH(CH₃)-O-)_n-R', where R and R' independently of one another, are branched or unbranched alkyl or alkenyl radicals and n is a number from 10 to 80,
 - of esterified fatty acid propoxylates of the general formula

- R-COO-(-CH₂-CH(CH₃)-O-)_n-C(O)-R', where R and R' independently of one another, are branched or unbranched alkyl or alkenyl radicals and n is a number from 10 to 80,
- of fatty acid propoxylates of the general formula
- 5 R-COO-(-CH₂-CH(CH₃)-O-)_n-H, where R is a branched or unbranched alkyl or alkenyl radical and n is a number from 10 to 80,
- of polypropylene glycol glycerol fatty acid esters of saturated and/or unsaturated, branched and/or unbranched fatty acids and [lacuna] a degree of propoxylation between 3 and 80
- 10 - of propoxylated sorbitan esters having a degree of propoxylation of from 3 to 100
- of cholesterolpropoxylates having a degree of propoxylation of from 3 to 100
 - of propoxylated triglycerides having a degree of propoxylation of
- 15 from 3 to 100
- of alkyl ether carboxylic acids of the general formula
- R-O-(-CH₂-CH(CH₃)-O-)_n-CH₂-COOH, or cosmetically or pharmaceutically acceptable salts thereof, where R is a branched or unbranched alkyl or alkenyl radical and n is a number from 3 to 50,
- 20 - of alkyl ether sulfates or the acids on which the sulfates are based of the general formula R-O-(-CH₂-CH(CH₃)-O-)_n-SO₃-H with cosmetically or pharmaceutically acceptable cations, where R is a branched or unbranched alkyl or alkenyl radical having 5 - 30 carbon atoms and n is a number from 1 to 50,
- 25 - of fatty alcohol ethoxylates/propoxylates of the general formula
- R-O-X_n-Y_m-H, where R is a branched or unbranched alkyl or alkenyl radical, where X and Y are not identical and in each case are either an oxyethylene group or an oxypropylene group and n and m independently of one another are numbers from 5 to 50,
- 30 - of polypropylene glycol ethers of the general formula.
- R-O-X_n-Y_m-R', where R and R', independently of one another, are branched or unbranched alkyl or alkenyl radicals, where X and Y are not identical and in each case are either an oxyethylene group or an oxypropylene group and n and m, independently of one
- 35 another are numbers from 5 to 100,
- of etherified fatty acid propoxylates of the general formula
- R-COO-X_n-Y_m-R', where R and R', independently of one another, are branched or unbranched alkyl or alkenyl radicals, where X and Y are not identical and in each case are either an oxyethylene group

- or an oxypropylene group and n and m, independently of one another, are numbers from 5 to 100,
- of fatty acid ethoxylates/propoxylates of the general formula $R-COO-X_n-Y_m-H$, where R is a branched or unbranched alkyl or alkenyl radical, where X and Y are not identical and in each case are either an oxyethylene group or an oxypropylene group and n and m, independently of one another, are numbers from 5 to 50.
 - Diacetyltartaric esters of mono/diglycerides
 - of partially neutralized esters of monoglycerides and/or diglycerides of saturated fatty acids with alpha-hydroxy acids.

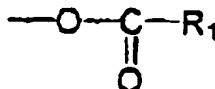
Suitable are

- glycerol esters of α -hydroxycarboxylic acids and saturated fatty acids chosen from the group of compounds represented by the generic formula



- where X, Y and Z, independently of one another, are chosen from the group

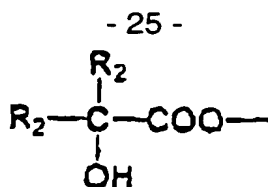
- (1) OH,
- (2) from the group of saturated branched and unbranched carboxylic acid radicals according to the formula



(formula 2)

where R is a branched or unbranched alkyl radical having 10 - 24 carbon atoms and

- (3) from the group of α -hydroxycarboxylic acid radicals according to the formula



(Formula 3)

(a) where R_2 and R_3 , independently of one another, are chosen from the group

- 5 (a1) H,
 (a2) branched or unbranched C_{1-25} -alkyl,
 (a3) branched or unbranched C_{1-25} -alkyl substituted by one or more carboxyl groups and/or hydroxyl groups and/or aldehyde groups and/or oxo groups (keto groups)

10 or

(b) where the α -carbon atom of the α -hydroxycarboxylic acid together with R_2 and R_3 forms an

(b1) unsubstituted cycloalkyl group having 3 to 7 ring atoms or a

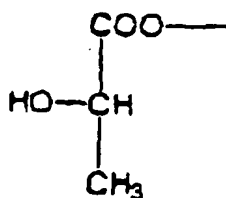
(b2) cycloalkyl group having 3 to 7 ring atoms and substituted by one
 15 or more carboxyl groups and/or hydroxyl groups and/or oxo groups (keto groups) and/or branched and/or unbranched C_{1-25} -alkyl groups,

and where, of the radicals X, Y and Z, only one must be a radical according to formula 3, only one must be a radical according to formula 2 and only one must be an OH group.

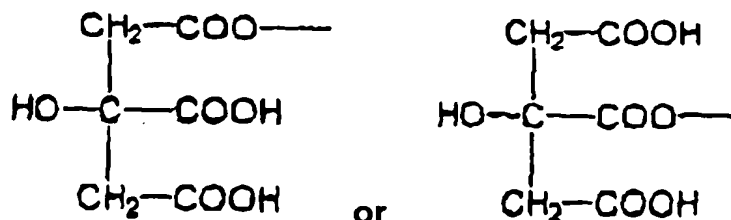
20

The glycerol esters of α -hydroxycarboxylic acids and saturated fatty acids for the purposes of the present invention are particularly advantageously chosen from the group in which the α -hydroxycarboxylic acid radical is a lactic acid radical

25



or a citric acid radical



It is also advantageous to choose the fatty acid radical such that R_1 is a C_{13} - C_{19} -alkyl radical.

5

Such lactic acid esters are available, for example, under the product name "LACTODAN B30" from Grinsted Prods.

10

Such citric acid esters are available, for example, under the product name "IMWITOR 370" from the company Hüls AG.

- water-dispersible W/O emulsifiers

- acyl lactylates of the formula

15 $R\text{-C(O)O-CH(CH}_3\text{)-C(O)O-CH(CH}_3\text{)CO}_2^-\text{M}^+$, where R is a saturated and/or unsaturated, branched and/or unbranched fatty acid having 6 to 26 carbon atoms.

- acyl glutamates of the formula

20 $R\text{-C(O)NHCH(COO}^-\text{, M}^+)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{COO}^-\text{M}^+$, where R is a saturated and/or unsaturated, branched and/or unbranched fatty acid having 6 to 26 carbon atoms.

- acyl sarcosinates of the formula

25 $R\text{-C(O)-N(CH}_3\text{)CH}_2\text{COO}^-\text{M}^+$, where R is a saturated and/or unsaturated, branched and/or unbranched fatty acid having 6 to 26 carbon atoms.

- isethionates of the formula

30 $RC(O)\text{-O-CH}_2\text{CH}_2\text{-SO}_3^-\text{M}^+$, where R is a saturated and/or unsaturated, branched and/or unbranched fatty acid having 6 to 26 carbon atoms.

- sulfosuccinates of the formula

$M^+, O-C(O)-CH_2-CH(SO_3-M^+)-C(O)-O-R$, where R is a saturated and/or unsaturated, branched and/or unbranched fatty acid having 6 to 26 carbon atoms.

- 5 - alaninates of the formula
 $CH_3CH_2N(CH_3)(C_{12}H_{25})C(O)O^-M^+$
- amphoacetates of the formula
 $R-C(O)-NH-CH_2CH_2-N(CH_2CH_2OH)-CH_2COO^-, M^+$
- 10 - alkyl glycosides, alkyl polyglycosides,
- esters of hydroxy acids

Particular preference is given to:

- 15 PEG-50 hydrogenated castor oil isostearate, PEG-45 palm kernel oil glycerides, polyglycerol-10 stearate, polyglycerol-10 laurate, PEG-20 glyceryl laurate, PEG-20 glyceryl stearate, PEG-20 monostearate, cetareth-12, oleth-15, Na lauryl ether sulfate, sodium glyceryl cocoyl sulfates, sodium lauroyl lactylate, sodium cocoyl glutamates, sodium cocoyl sarcosinates, PEG-20 sorbitan isostearate, PEG-20 sorbitan
- 20 monooleate, diacetyl tartaric acid mono/dilinoleates, glyceryl linoleate citrate, sodium laureth-11 carboxylate, polyethylene glycol(30) cholesteryl ether, polyethylene glycol(60) evening primrose glycerides, lauryl glycoside, C12-C13-alkyl malic acid esters, C12-C13 tartaric acid esters.

- 25 It is, however, also possible not to use any sorbitan esters or sorbitan ester derivatives in the preparations according to the invention.

The oils and fats customary in cosmetics can be used as oil phase.

- 30 The process according to the invention permits the preparation of finely divided microemulsions (the droplet size is about 10-100 nm) with a large number of typical oil phases: e.g. ethers (dicaprylyl ether), triglycerides (caprylic capric triglycerides), alcohols (octyldodecanol), ester oils (cetearyl isononanoate), hydrocarbons (dioctyl cyclohexane), paraffins, silicone oils
- 35 (cyclomethicone) and mixtures of these oil phases.

Where appropriate, the oil phase of the preparations in particular may also comprise sphingolipids and/or glycolipids of synthetic or natural origin, in particular ceramides, sphingomyelins, cerebroside and/or gangliosides.

The proportion of these lipids may be e.g. 0 to 10% by weight, preferably 0 - 2% by weight, in particular 0 - 1% by weight, in each case based on the total weight of the preparations.

- 5 In addition, the process presented above opens up the possibility of also utilizing the viscosity-increased states described previously, such as, for example, gels, as administration system.

Thus, these gels can be applied by the consumer, for example as hairgel.

- 10 Dilution of these gels then leads, depending on the O/W emulsifier used and oil phase used, to O/W microemulsions or O/W macroemulsions on the scalp.

In addition, shower oils (foaming, nonfoaming) can be applied topically with utilization of the gel phases according to the invention. The shower water
15 converts the gel on the skin into a water-continuous microemulsion or macroemulsion. In this case, the phospholipid added and further ingredients in the preparation remain on the skin (refatting).

- In addition, these gels can advantageously be used for removing skin impurities. The gels have the advantageous property of solubilizing lipid-
20 soluble impurities of the skin. These face/body cleansing gels can then be diluted with water by the user, the sebum being solubilized in the oil droplets, thus enabling pore-deep cleansing of the skin. At the same time, some of the phospholipid remains on the skin and thus increases the moisture content.

- 25 For the gels, preference is given to the following percentage amounts by weight, in each case based on the total weight of the preparations:

- | | | |
|----|--------------------------------|---------------|
| 30 | Lecithin: | 0.1 - 50% |
| | O/W emulsifier: | 0.1-70% |
| | Oil phase: | 5 - 90% |
| | Additives for the oil phase: | 0.01-15% |
| | Additives for the water phase: | 0.01-35% |
| | Water | 0.1-75% water |

- 35
- | | | |
|--|-----------------|-----------|
| | Lecithin: | 0.1 - 40% |
| | O/W emulsifier: | 0.1-70% |
| | W/O emulsifier | 01.-50% |
| | Oil phase: | 5-90% |

Additives for the oil phase: 0.01-15%

Additives for the water phase: 0.01-35%

Water 0.1-75% water

- 5 For the microemulsion according to the invention, preference is given to the following percentage amounts by weight, in each case based on the total weight of the preparations:

- 10 Lecithin: 0.01-10%, in particular 0.1-5.0%
O/W emulsifier: 0.01-60%, in particular 0.1-10%
Oil phase: 0.01-50%, in particular 0.1-30%
Additives for the oil phase: 0.01-20%, in particular 0.1-15%
Additives for the water phase: 0.01-80%, in particular 0.1-60%
Water 40-99%
- 15 Lecithin: 0.01-10%, in particular 0.1-5.0%
O/W emulsifier: 0.01-60%, in particular 0.1-10%
W/O emulsifier 0.01-10%, in particular 0.1-5.0%
Oil phase: 0.01-50%, in particular 0.1-30%
20 Additives for the oil phase: 0.01-20%, in particular 0.1-15%
Additives for the water phase: 0.01-80%, in particular 0.1-60%
Water 40-99%

Additives may also be auxiliaries or active ingredients.

- 25 The lecithin/O/W emulsifier weight ratio in the preparations according to the invention can vary, e.g. from 1:30 to 2:1. The lecithin/OW emulsifier ratio is preferably 1:15 to 1:1. The lecithin/OW emulsifier ratio is particularly preferably 1:6 to 1:1.5.

- 30 The gels and microemulsions according to the invention can optionally also comprise one or more water-in-oil emulsifiers.

- The W/O emulsifiers are to be used particularly advantageously if, for example, active ingredients are to be solubilized in the microemulsions which tend toward storage instabilities only in the presence of the O/W emulsifier and of the lecithin.
- 35

Preference is given to emulsifiers with a HLB value in the range from 1-10.

Preference is given to using the following W/O emulsifiers:

one or more polyethoxylated W/O emulsifiers and/or

one or more polyproxylated W/O emulsifiers and/or
one or more polyethoxylated and polypropoxylated W/O
emulsifiers

and/or

- 5 one or more monoesters, diesters, polyesters, polyols as W/O emulsifiers and/or
- one or more monoethers of polyols and esters thereof as W/O emulsifiers and/or
 - one or more sorbitan esters as W/O emulsifiers and/or
- 10 - one or more silicone emulsifiers as W/O emulsifiers and/or
- one or more fatty alcohols or fatty acids as W/O emulsifiers and/or
 - one or more methylglucose esters as W/O emulsifiers,
- where this W/O emulsifier is chosen from the group o
- 15
- fatty alcohol ethoxylates of the general formula $R-O-(CH_2-CH_2-O)_n-H$, where R is a branched or unbranched alkyl, aryl or alkenyl radical and n is a number from 1 to 10
- 20
- polyethylene glycol ethers of the general formula $R-O-(CH_2-CH_2-O)_n-R'$, where R and R', independently of one another, are branched or unbranched alkyl or alkenyl radicals and n is a number from 1 to 30
- 25
- fatty acid ethoxylates of the general formula $R-COO-(CH_2-CH_2-O)_n-H$, where R is a branched or unbranched alkyl or alkenyl radical and n is a number from 1 to 20,
- 30
- esterified fatty acid ethoxylates of the general formula $R-COO-(CH_2-CH_2-O)_n-C(O)-R'$, where R and R', independently of one another, are branched or unbranched alkyl or alkenyl radicals and n is a number from 1 to 20,
- 35
- esterified fatty acid ethoxylates of the general formula $R-COO-(CH_2-CH_2-O)_n-C(O)-R'$, where R and R', independently of one another, are branched or unbranched alkyl, hydroxyalkyl or alkenyl radicals and n is a number from 1 to 40,
- etherified fatty acid ethoxylates of the general formula

- R-COO-(-CH₂-CH₂-O-)_n-R', where R and R', independently of one another, are branched or unbranched alkyl or alkenyl radicals and n is a number from 1 to 40
- fatty alcohol propoxylates of the general formula
5 R-O-(-CH₂-CH(CH₃)-O-)_n-H, where R is a branched or unbranched alkyl or alkenyl radical and n is a number from 1 to 30,
 - polyoxyethylene sorbitan fatty acid esters based on branched or unbranched alkanolic or alkenolic acids and having a degree of
10 ethoxylation of from 1 to 10
 - cholesterol ethoxylates having a degree of ethoxylation between 1 and 10,
 - 15 - ethoxylated glycerides having a degree of ethoxylation of from 1 to 30
 - ethoxylated triglycerides having a degree of ethoxylation between 1 and 30,
 - 20 - monoglycerol ethers of the type R-O-CH₂-C(H)OH-CH₂OH where R are a branched or unbranched alkyl, aryl or alkenyl radical and
 - monoglycerol esters of the type RC(O)OCH₂-C(H)OH-CH₂OH where
25 R are a branched or unbranched alkyl, hydroxyalkyl, aryl or alkenyl radical
 - diglycerol esters of the type RC(O)OCH₂-C(H)OH-CH₂OC(O)R' where where R and R', independently of one another, are branched
30 or unbranched alkyl, hydroxyalkyl, or alkenyl radicals and n is a number from 1 to 30 or,
 - polyglycerol monoesters or diesters or polyesters, where the fatty acids, independently of one another, are branched or unbranched
35 alkyl, hydroxyalkyl or alkenyl radicals,
 - pentaerythritol esters, where the fatty acids, independently of one another, are branched or unbranched alkyl, hydroxyalkyl or alkenyl radicals,

- propylene glycol esters, where the fatty acids, independently of one another, are branched or unbranched alkyl, hydroxyalkyl or alkenyl radicals,
- 5 - sorbitan esters, where the fatty acids, independently of one another, are branched or unbranched alkyl, hydroxyalkyl or alkenyl radicals,
- fatty alcohols R-OH and fatty acids RCOOH, where R are a branched or unbranched alkyl or alkenyl radical,
- 10 - silicone emulsifiers
- methylglucose esters, where the fatty acids, independently of one another, are branched or unbranched alkyl, hydroxyalkyl or alkenyl radicals
- 15 - fatty alcohols having 8 to 30 carbon atoms,
- diglycerol ethers, where the fatty acids, independently of one another, are branched or unbranched alkyl hydroxyalkyl or alkenyl radicals
- 20 - sucrose esters, where the fatty acids, independently of one another, are branched or unbranched alkyl, hydroxyalkyl or alkenyl radicals

Particularly advantageous W/O emulsifiers are glyceryl monoisostearate, glyceryl monoisostearate, diglyceryl monostearate, diglyceryl
 25 monoisostearate, propylene glycol monostearate, sorbitan monoisostearate, cetyl alcohol, archidyl alcohol, selachyl alcohol, chimyl alcohol, glyceryl monolaurate, glyceryl monocaprate, glyceryl monocaprylate, steareth-2, polyethylene glycol(4) stearate, polyethylene glycol(12) dilaurate, polyethylene glycol(8) distearate. Polyethylene
 30 glycol(20) sorbitan trioleate, polyethylene glycol(20) sorbitan triisostearate, polyethylene glycol(5) phytosterol, polyethylene glycol(20), glyceryl tristearate, polyethylene glycol(5) glyceryl stearate, 2-ethylhexyl glycerol ether, polyglyceryl-2 dipolyhydroxystearate, cetyldimethicone copolyol, isostearic acid, linoleic acid, linolenic acid.

35

The lecithin/(OW emulsifier and W/O emulsifier) weight ratio in the preparations according to the invention can vary, e.g. from 1:30 to 2:1. The lecithin/(O/W emulsifier and W/O emulsifier) ratio is preferably 1:15 to 1:1.

The lecithin/O/W emulsifier and W/O emulsifier is particularly preferably 1:6 to 1:1.5.

5 The gels or microemulsions according to the invention can have high oil phase fractions. In particular, they can be used for the treatment of skin roughness and for skin smoothing and they bring about an increase in skin moisture.

10 The preparations described below can be gels or microemulsions according to the invention.

The gels or microemulsions according to the invention can be used as administration systems for e.g. cosmetic or e.g. dermatological active ingredients, additives, or auxiliaries. They are preferably applied topically.

15 The gels according to the invention can be used as administration system (make-up remover, hair gel, face cleansing gel, bodycare gel). The gels according to the invention can be converted in the presence of water into other colloidochemical phases, such as, for example, O/W microemulsions and O/W macroemulsions. In the presence of an O/W emulsifier and optionally a W/O emulsifier, gel-like preparations can be obtained which can be converted into low-viscosity, lecithin-containing O/W microemulsions in a targeted manner by dilution with water.

25 If the gels and microemulsions according to the invention are bases for cosmetic deodorants/antiperspirants, then all customary active ingredients may advantageously be used, for example odor maskers, such as the customary perfume constituents, odor absorbers, for example the phyllosilicates described in patent laid-open specification DE-P 40 09 347, and of these in particular montmorillonite, kaolinite, illite, beidelite, nontronite, saponite, hectorite, bentonite, smectite, and also, for example, zinc salts of ricinoleic acid. Germicidal agents are likewise suitable to be incorporated into the microemulsions according to the invention. Advantageous substances are, for example, 2,4,4'-trichloro-2'-hydroxydiphenyl ether (Irgasan), 1,6-di(4-chlorophenylbiguanido)hexane (chlorhexidine), 3,4,4'-trichlorocarbanilide, quaternary ammonium compounds, oil of cloves, mint oil, oil of thyme, triethyl citrate, farnesol (3,7,11-trimethyl-2,6,10-dodecatrien-1-ol) and the active agents described in patent laid-open specifications DE-37 40 186, DE-39 38 140, DE-42 04

321, DE-42 29 707, DE-42 29 737, DE-42 37 081, DE-43 09 372, DE-43 24 219.

5 The customary antiperspirant active ingredients can likewise advantageously be used in the microemulsions according to the invention, in particular astringents, for example basic aluminum chlorides.

10 The amount of deodorant active ingredients and/or antiperspirant active ingredients can, for example, be 0.001 to 50% by weight, preferably 0.1 to 35% by weight, in each case based on the total weight of the preparation.

15 The cosmetic deodorants according to the invention can be in the form of aerosols, that is to say preparations which can be sprayed from aerosol containers, squeezable bottles or by a pump device, or in the form of liquid compositions which can be applied by means of roll-on devices, but also in the form of microemulsions which can be applied from normal bottles and containers.

20 Suitable propellants for cosmetic deodorants according to the invention which can be sprayed from aerosol containers are the customary known readily volatile, liquefied propellants, for example hydrocarbons (propane, butane, isobutane), which can be used on their own or as a mixture with one another. Compressed air can also be used advantageously.

25 The person skilled in the art naturally knows that there are propellant gases which are nontoxic per se and would in principle be suitable for the present invention, but which should nevertheless be omitted because of an unacceptable impact on the environment or other concomitant circumstances, in particular chlorofluorocarbons (CFCs).

30 Moreover, it has surprisingly been found that if propellants which are soluble in the oil phase are used, i.e. for example customary propane/butane mixtures, the O/W microemulsions according to the invention are sprayed not simply as aerosol droplets, but develop to give
35 fine-bubbled, rich foams as soon as those systems charged with such propellants experience decompression.

Such after-foaming preparations are therefore likewise to be regarded as advantageous embodiments of the present invention with an independent inventive step.

- 5 If propellants which are insoluble in the oil phase are used, the O/W microemulsions according to the invention are sprayed as aerosol droplets.

Also favorable are those cosmetic and dermatological preparations which are in the form of a sunscreen. In addition to the active ingredient combinations according to the invention, these preferably additionally
10 comprise at least one UVA filter substance and/or at least one UVB filter substance and/or at least one inorganic pigment.

It is, however, also advantageous for the purposes of the present
15 inventions to provide cosmetic and dermatological preparations whose main purpose is not protection from sunlight, but which nevertheless comprise a content of UV protection substances. Thus, for example, UV-A or UV-B filter substances are usually incorporated into day creams.

20 Preparations according to the invention may advantageously comprise substances which absorb UV radiation in the UVB region, the total amount of filter substances being, for example, 0.1% by weight to 30% by weight, preferably 0.5 to 10% by weight, in particular 1 to 6% by weight, based on the total weight of the preparations.

25

The UV filters may be oil-soluble or water-soluble. Examples of oil-soluble substances are:

- 3-benzylidenecamphor and its derivatives, e.g. 3-(4-methylbenzylidene)camphor,
- 30 - 4-aminobenzoic acid derivatives, preferably 2-ethylhexyl 4-(dimethylamino)benzoate and amyl 4-(dimethylamino)benzoate;
- esters of cinnamic acid, preferably 2-ethylhexyl 4-methoxycinnamate, isopentyl 4-methoxycinnamate;
- esters of salicylic acid, preferably 2-ethylhexyl salicylate, 4-isopropylbenzyl salicylate and homomethyl salicylate;
- 35 - derivatives of benzophenone, preferably 2-hydroxy-4-methoxybenzophenone, 2-hydroxy-4-methoxy-4'-methylbenzophenone, 2,2'-dihydroxy-4-methoxybenzophenone;

- esters of benzalmalonic acid, preferably di(2-ethylhexyl) 4-methoxybenzalmalonate;
- 2,4,6-trianilino(p-carbo-2'-ethyl-1'-hexyloxy)-1,3,5-triazine

5 Advantageous water-soluble substances are:

- 2-phenylbenzimidazol-5-sulfonic acid and salts thereof, e.g. sodium, potassium or triethanolammonium salts,
- sulfonic acid derivatives of benzophenones, preferably 2-hydroxy-4-methoxybenzophenone-5-sulfonic acid and its salts;
- 10 - sulfonic acid derivatives of 3-benzylidenecamphor, such as, for example, 4-(2-oxo-3-bornylidenemethyl)benzenesulfonic acid, 2-methyl-5-(2-oxo-3-bornylidenemethyl)sulfonic acid and salts thereof.

15 The list of said UVB filters which can be used according to the invention is not of course intended to be limiting.

The invention also provides the combination of a UVA filter with a UVB filter or a cosmetic or dermatological preparation according to the invention which also comprises a UVB filter.

20

It may also be advantageous to use in preparations according to the invention UVA filters which are customarily present in cosmetic and/or dermatological preparations. Such substances are preferably derivatives of dibenzoylmethane, in particular 1-(4'-tert-butylphenyl)-3-(4'-methoxyphenyl)propane-1,3-dione and 1-phenyl-3-(4'-isopropylphenyl)propane-1,3-dione. Preparations which comprise these combinations are also provided by the invention. The amounts of UVA filter substances used are the same as those given for UVB filter substances.

25

30 Cosmetic and/or dermatological preparations according to the invention can also comprise inorganic pigments which are customarily used in cosmetics for protecting the skin against UV rays. These are oxides of titanium, zinc, iron, zirconium, silicon, manganese, aluminum, cerium and mixtures thereof, and also modification in which the oxides are the active agents. Particular preference is given to pigments based on titanium dioxide. The amounts used may be those given for the above combinations.

35

A surprising property of the present invention is that preparations according to the invention are very good vehicles for cosmetic or dermatological active ingredients into the skin, advantageous active ingredients being antioxidants which are able to protect the skin against oxidative stress.

According to the invention, the preparations advantageously comprise one or more antioxidants. Favorable, but nevertheless optional, antioxidants are all antioxidants customary or suitable for cosmetic and/or dermatological applications. It is advantageous here to use antioxidants as the sole class of active ingredient, say, when a cosmetic or dermatological application is a priority, such as the combating of oxidative stress of the skin. It is, however, also favorable to provide the microemulsions according to the invention with a content of one or more antioxidants if the preparations are to serve another purpose, e.g. as deodorants or sunscreen compositions.

The antioxidants are particularly advantageously chosen from the group consisting of amino acids (e.g. histidine, tyrosine, tryptophan) and derivatives thereof, imidazoles (e.g. urocanic acid) and derivatives thereof, peptides, such as D,L-carnosine, D-carnosine, L-carnosine and derivatives thereof (e.g. anserine), carotenoids, carotenes (e.g. α -carotene, β -carotene, lycopene) and derivatives thereof, lipoic acid and derivatives thereof (e.g. dihydrolipoic acid), aurothioglucose, propylthiouracil and other thiols (e.g. thioredoxin, glutathione, cysteine, cystine, cystamine and the glycosyl, N-acetyl, methyl, ethyl, propyl, amyl, butyl and lauryl, palmitoyl, oleyl, gamma-linoleyl, cholesteryl and glyceryl esters thereof) and salts thereof, dilauryl thiodipropionate, distearyl thiodipropionate, thiodipropionic acid and derivatives thereof (esters, ethers, peptides, lipids, nucleotides, nucleosides and salts), and sulfoximine compounds (e.g. buthionine-sulfoximines, homocysteine-sulfoximine, buthionine-sulfones and penta-, hexa- and heptathionine-sulfoximine) in very low tolerated doses (e.g. pmol to μ mol/kg), and also (metal) chelating agents (e.g. α -hydroxy fatty acids, α -hydroxypalmitic acid, phytic acid, lactoferrin), α -hydroxy acids (e.g. citric acid, lactic acid, malic acid), humic acid, bile acid, bile extracts, bilirubin, biliverdin, EDTA, EGTA and derivatives thereof, unsaturated fatty acids and derivatives thereof (e.g. gamma-linolenic acid, linoleic acid, oleic acid), folic acid and derivatives thereof, ubiquinone and ubiquinol derivatives thereof, vitamin C and derivatives (e.g. ascorbyl palmitates, Mg ascorbyl

phosphates, and ascorbyl acetates), tocopherols and derivatives (e.g. vitamin E acetate) vitamin A and derivatives (vitamin A palmitate), and coniferyl benzoate of benzoin resin, rutinic acid and derivatives thereof, ferulic acid and derivatives thereof, butyl hydroxytoluene, butyl
5 hydroxyanisol, nordihydroguaiiacic acid, nordihydroguaiaretic acid, trihydroxybutyrophenone, uric acid and derivatives thereof, zinc and derivatives thereof (e.g. ZnO, ZnSO₄) selenium and derivatives thereof (e.g. selenomethionine), stilbenes and derivatives thereof (e.g. stilbene oxide, trans-stilbene oxide) and the derivatives (salts, esters, ethers,
10 sugars, nucleotides, nucleosides, peptides and lipids) of said active ingredients which are suitable according to the invention.

Oil-soluble antioxidants may be used particularly advantageously for the purposes of the present invention.

15

The amount of antioxidants (one or more compounds) in the preparations is preferably 0.001 to 30% by weight, particularly preferably 0.05 - 20% by weight, in particular 1 - 10% by weight, based on the total weight of the preparation.

20

If vitamin E and/or derivatives thereof are the antioxidant(s), it is advantageous to choose their respective concentrations from the range from 0.001 - 10% by weight, based on the total weight of the formulation.

25 If vitamin A or vitamin A derivatives, or carotenes or derivatives thereof are the antioxidant(s), it is advantageous to choose their respective concentrations from the range from 0.001 - 10% by weight, based on the total weight of the formulation.

30 The person skilled in the art is of course aware that exacting cosmetic preparations are usually inconceivable without the customary auxiliaries and additives. These include, for example, bodying agents, fillers, perfume, dyes, emulsifiers, additional active ingredients such as vitamins or proteins, light protection agents, stabilizers, insect repellents, alcohol,
35 water, salts, antimicrobial, proteolytic or keratolytic substances etc.

If desired, the water phase of the O/W microemulsions according to the invention can also comprise thickeners, so that the overall preparation appears gel-like and is to be regarded as a microemulsion gel. Suitable

thickeners have proven to be, for example, carrageenan or PEG-4 rapeseed amides and laureth-2 amide MEA.

5 According to the invention, active ingredients can also very advantageously be chosen from the group of lipophilic active ingredients, in particular from the following group:

10 acetylsalicylic acid, atropine, azulene, hydrocortisone and derivatives thereof e.g. hydrocortisone-17 valerate, vitamins, e.g. ascorbic acid and derivatives thereof, vitamins of the B and D series, very preferably vitamin B₁, vitamin B₁₂ and vitamin D₁, but also bisabolol, unsaturated fatty acids, namely the essential fatty acids (also often called vitamin F), in particular
15 gamma-linolenic acid, oleic acid, eicosapentaenoic acid, docosahexaenoic acid and derivatives thereof, chloramphenicol, caffeine, prosaglandins, thymol, camphor, extracts or other products of plant and animal origin, for example evening primrose oil, borage oil or currant kernel oil, fish oils, cod-liver oil and also ceramides and ceramide-like compounds.

20 Although the use of hydrophilic active ingredients is of course also favored according to the invention, a further advantage of the microemulsions according to the invention is that the high number of very finely divided droplets makes precisely oil-soluble or lipophilic active ingredients bioavailable with particularly high effectiveness.

25 It is also advantageous to choose the active ingredients from the group of refatting substances, for example purcellin oil, Eucerite® and Neocerite®.

30 It is also possible and, in some instances, advantageous to add washing-active surfactants to the preparations according to the invention. Aqueous cosmetic cleansing agents according to the invention or low-water or anhydrous cleansing agent concentrates intended for aqueous cleansing may comprise cationic, anionic, nonionic and/or amphoteric surfactants, for example conventional soaps, e.g. fatty acid salts of sodium, alkyl sulfates, alkyl ether sulfates, alkane- and alkylbenzenesulfonates, sulfoacetates,
35 sulfobetaines, sarcosinates, amidosulfobetaines, sulfosuccinates, sulfosuccinic monoesters, alkyl ethyl carboxylates, protein fatty acid condensates, alkylbetaines and amidobetaines, fatty acid alkanolamides, polyglycol ether derivatives.

Cosmetic preparations which are cosmetic cleansing preparations for the skin may be in liquid or semisolid form, for example as gels or microemulsions. They preferably comprise at least one anionic, cationic, nonionic or amphoteric surface-active substance or mixtures thereof, optionally electrolytes and auxiliaries, as are customarily used for this purpose. The surface-active substance can preferably be present in a concentration between 1 and 30% by weight in the cleansing preparations, based on the total weight of the preparations.

- 10 Cosmetic preparations which are shampoos preferably comprise at least one anionic, nonionic or amphoteric surface-active substance or mixtures thereof, optionally electrolytes and auxiliaries, as are customarily used for this purpose. The surface-active substance can preferably be present in a concentration between 1 and 50% by weight in the cleansing preparations, based on the total weight of the preparations. Cetyltrimethylammonium salts, for example, are to be used advantageously.

20 The preparations intended for cleansing the hair or the skin comprise, apart from the abovementioned surfactants, water and optionally the additives customary in cosmetics, for example perfume, thickeners, dyes, deodorants, antimicrobial substances, refatting agents, complexing and sequestering agents, pearly luster agents, plant extracts, vitamins, active ingredients and the like.

- 25 Despite their oil content, the preparations according to the invention surprisingly have very good foam development, high cleansing power and have a high regeneration action with regard to the general condition of the skin. In particular, the preparations according to the invention have a skin-smoothing action, reduce the feeling of dryness of the skin and make the skin supple.

35 According to the invention, it is, for example, possible to apply a mixture of lecithin/PEG-20 sorbitan isostearate/octyldodecanol/glycerol to the hair such that, for example, a stay-in conditioner product arises. In addition, the products can also be provided with propellant gas and be applied into the hair (or onto the skin) as a mousse.

According to the invention, it is also possible to topically apply a mixture of lecithin/PEG-20 sorbitan isostearate/caprylic/capric triglyceride/glycerol and to achieve a significant moisturization of the skin, skin smoothing and

a reduction in skin flakiness. In particular, it is also advantageous to use octyldodecanol or cetearyl isonanoate or diocetyl cyclohexane as oil phase instead of the triglyceride and to achieve the advantages described for the triglycerides.

5

If the gels or microemulsions according to the invention are to be used for haircare, they may comprise the customary constituents, usually, for example, film-forming polymers. Of such polymers having at least partially quaternized nitrogen groups (called "film formers" below), those which are preferably suitable are those chosen from the group of substances which carry the name, according to INCI nomenclature (International Nomenclature Cosmetic Ingredient) "polyquaternium", for example:

- 15 Polyquaternium-2 (chemical abstract No. 63451-27-4, e.g. Mirapol®A-15)
- Polyquaternium-5 (copolymer of acrylamide and β -methacryloxyethyltrimethylammonium methosulfate, CAS No. 26006-22-4)
- Polyquaternium-6 (homopolymer of N,N-dimethyl-N-2-propenyl-2-propene-1-aminium chloride, CAS No. 26062-79-3, e.g. Merquat® 100
- 20 Polyquaternium-7 N,N-dimethyl-N-2-propenyl-2-propene-1-aminiumchloride, polymer with 2-propeneamide, CAS No. 26590-05-6, e.g. Merquat® S
- Polyquaternium-10 quaternary ammonium salt of hydroxyethylcellulose, CAS No. 53568-66-4, 55353-19-0, 54351-50-7, 68610-92-4, 81859-24-7 e.g. Celquat® SC-230M,
- 25 Polyquaternium-11 vinylpyrrolidone/dimethylaminoethyl methacrylate copolymer/diethyl sulfate reaction product, CAS No. 53633-54-8, e.g. Gafquat® 755N
- 30 Polyquaternium-16 vinylpyrrolidone/vinylimidazolinium methochloride copolymer, CAS No. 29297-55-0, e.g. Luviquat® HM 552
- Polyquaternium-17 CAS No. 90624-75-2, e.g. Mirapol® AD-1
- Polyquaternium-19 quaternized water-soluble polyvinyl alcohol
- 35 Polyquaternium-20 quaternized polyvinyl octadecyl ether dispersible in water
- Polyquaternium-21 polysiloxane-polydimethyl-dimethylammonium acetate copolymer, e.g. Abil® B 9905

- Polyquaternium-22 dimethyldiallylammonium chloride/acrylic acid copolymer, CAS No. 53694-7-0, e.g. Merquat® 280
- Polyquaternium-24 polymeric quaternary ammonium salt of hydroxyethylcellulose, reaction product with an epoxide substituted by lauryldimethylammonium, CAS No. 107987-23-5, e.g. Quatrisoft® LM-200
- Polyquaternium-28 vinylpyrrolidone/methacrylamidopropyltrimethyl ammonium chloride copolymer, e.g. Gafquat® HS-100
- Polyquaternium-29 e.g. Lexquat® CH
- Polyquaternium-31 CAS No. 136505-02-7, e.g. Hypan® QT 100
- Polyquaternium-32 N,N,N-trimethyl-2-[(2-methyl-1-oxo-2-propenyl)oxy] ethaneaminium chloride, polymer with 2-propenamide, CAS No. 35429-19-7
- Polyquaternium-37 CAS No. 26161-33-1
- 15 Cetryltrimethylammonium salts, such as CTAB, CTAC.
- Preparations for haircare according to the invention advantageously comprise 0.01 - 5% by weight of one or more film formers, preferably 0.1 - 3% by weight, in particular 0.2 - 2% by weight, in each case based on the total weight of the preparations. Such embodiments of the preparations
- 20 according to the invention care for hair which has been damaged or worn out by environmental influences, or protect against such environmental influences. In addition, the preparations according to the invention impart loose body and hold to the hairstyle, without being sticky.
- 25 Accordingly the preparations according to the invention can, depending on their composition, be used, for example, as skin protection emulsion, cleansing milk, sunscreen lotion, nourishing lotion, day or night emulsion etc.
- 30 The microemulsions according to the invention also advantageously contribute to skin smoothing, particularly if they are provided with one or more substances which promote skin smoothing.
- Where appropriate, it is possible and advantageous to use the
- 35 preparations according to the invention as a base for pharmaceutical formulations. Corresponding requirements apply mutatis mutandis to the formulation of medicinal preparations. The transitions between pure cosmetics and pure pharmaceuticals are fluid in this connection. According to the invention, suitable pharmaceutical active ingredients are in principle

all classes of active ingredient, preference being given to lipophilic active ingredients. Examples are: antihistamines, antiphlogistics, antibiotics, antimykotics, active ingredients which promote circulation, keratolytics, hormones, steroids, vitamins etc.

5

The cosmetic and dermatological preparations according to the invention can comprise cosmetic auxiliaries as are customarily used in such preparations, e.g. preservatives, bactericides, virucides, perfumes, antifoams, dyes, pigments which have a coloring action, thickeners,
10 surface-active substances, emulsifiers, emollients, moisturizers and/or humectants, antiinflammatory substances, medicaments, fats, oils, waxes or other customary constituents of a cosmetic or dermatological formulation, such as alcohols, polyols, polymers, foam stabilizers, electrolytes, organic solvents.

15

Mixtures of the abovementioned solvents are used particularly advantageously.

Other constituents which may be used are fats, waxes and other natural
20 and synthetic fatty substances, preferably esters of fatty acids with alcohols of low carbon number, e.g. with isopropanol, propylene glycol or glycerol, or esters of fatty alcohols with alkanolic acids of low carbon number or with fatty acids, alcohols, diols or polyols of low carbon number, and ethers thereof, preferably ethanol, isopropanol, propylene glycol,
25 glycerol, ethylene glycol, ethylene glycol monoethyl or monobutyl ether, propylene glycol monomethyl, monoethyl or monobutyl ether, diethylene glycol monomethyl or monoethyl ether and analogous products.

Unless stated otherwise, all amounts, percentages or parts refer to the
30 weight of the preparations or of the respective mixture.

The examples below serve to illustrate the present invention.

The lecithin used in the examples below is Phospholipon 90 (Rhône-Poulenc, FR).
35

Instead of the ethoxylated sorbitan esters, it is also possible, for example, to use in each case PEG-50 hydrogenated castor oil isostearate with equal success.

Example 1

Face tonic

% by wt.

5		
	Lecithin	0.5%
	PEG-20 sorbitan isostearate	2.5%
	Glycerol isostearate	0.5%
	Glycerol	5.000
10	Cetearyl isononanoate	2.500
	Preservative	q.s.
	Water	ad
		100.000

- 15 The oil phase and the water phase are each heated separately to 70 - 75°C. The water phase is added dropwise to the oil phase, and a gel forms. The further dropwise addition of the water phase and cooling of the mixture produces an O/W microemulsion.

20 Example 2

Face tonic

% by wt.

25	Lecithin	0.5%
	PEG-20 sorbitan isostearate	2.5%
	Sorbitan isostearate	0.5%
	Glycerol	5.000
	Cetearyl isononanoate	2.500
30	Preservative	q.s.
	Water	ad
		100.000

- 35 The oil phase and the water phase are each heated separately to 70 - 75°C. The water phase is added dropwise to the oil phase, and a gel forms. The further dropwise addition of the water phase and cooling of the mixture produces an O/W microemulsion.

Example 3

Face tonic

	% by wt.
5	
Lecithin	0.5%
PEG-20 sorbitan isostearate	2.5%
Steareth-2	0.5%
Glycerol	5.000
10 Cetearyl isononanoate	2.500
Preservative	q.s.
Water	ad
	100.000

- 15 The oil phase and the water phase are each heated separately to 70 - 75°C. The water phase is added dropwise to the oil phase, and a gel forms. The further dropwise addition of the water phase and cooling of the mixture produces an O/W microemulsion.

20 Example 4

Face tonic

	% by wt.
25	
Lecithin	1.0%
PEG-20 sorbitan isostearate	2.5%
Phenylbenzimidazolesulfonic acid	3.0%
Sodium hydroxide	1.0%
Glycerol	5.000
30 Cetearyl isononanoate	2.500
Preservative	q.s.
Water	ad
	100.000

- 35 The oil phase and the water phase are each heated separately to 70 - 75°C. The water phase is added dropwise to the oil phase, and a gel forms. The further dropwise addition of the water phase and cooling of the mixture produces an O/W microemulsion.

Example 5

Face tonic

	% by wt.
5	
Lecithin	0.5%
PEG-20 sorbitan isostearate	2.5%
Glycerol isostearate	0.5%
Glycerol	5.000
10 Cetearyl isononanoate	2.500
Preservative	q.s.
Water	ad
	100.000

- 15 The oil phase and the water phase are each heated separately to 70 - 75°C. The water phase is added dropwise to the oil phase, and a gel forms. The further dropwise addition of the water phase and cooling of the mixture produces an O/W microemulsion.

20 Example 6

Face tonic

	% by wt.
Lecithin	1.800
25 PEG-50 hydrogenated castor oil isostearate	5.200
Glycerol	5.000
Dicaprylyl ether	5.000
Preservative	q.s.
Water	ad
30	100.000

- 35 The oil phase and the water phase are each heated separately to 70 - 75°C. The water phase is added dropwise to the oil phase, and a gel forms. The further dropwise addition of the water phase and cooling of the mixture produces an O/W microemulsion.

Example 7

Antiacne lotion

	% by wt.
Lecithin	3.000
PEG-20 sorbitan isostearate	4.000
Glycerol	5.000
5 Dicaprylyl ether	5.000
Preservative	q.s.
Water	ad
	100.000

- 10 The oil phase and the water phase are each heated separately to 70 - 75°C. The water phase is added dropwise to the oil phase, and a gel forms. The further dropwise addition of the water phase and cooling of the mixture produces an O/W microemulsion.

15 Example 8

Hair tonic	
	% by wt.
Lecithin	3.000
20 Oleth-15	4.000
Glycerol	5.000
Dicaprylyl ether	5.000
Preservative	q.s.
Water	ad
25	100.000

- The oil phase and the water phase are each heated separately to 70 - 75°C. The water phase is added dropwise to the oil phase, and a gel forms. The further dropwise addition of the water phase and cooling of the mixture produces an O/W microemulsion.
- 30

Example 9

Body lotion	
	% by wt.
Lecithin	3.000
PEG-45 palm kernel oil glycerides	4.000
Glycerol	5.000
Dicaprylyl ether	5.000

Preservative	q.s.
Water	ad
	100.000

- 5 The oil phase and the water phase are each heated separately to 70 - 75°C. The water phase is added dropwise to the oil phase, and a gel forms. The further dropwise addition of the water phase and cooling of the mixture produces an O/W microemulsion.

10 Example 10

Base formulation for shaving foam

	% by wt.
Lecithin	3.000
15 PEG-20 sorbitan monooleate	4.000
Glycerol	5.000
Dicaprylyl ether	5.000
Preservative	q.s.
Water	ad
20	100.000

- The oil phase and the water phase are each heated separately to 70 - 75°C. The water phase is added dropwise to the oil phase, and a gel forms. The further dropwise addition of the water phase and cooling of the mixture produces an O/W microemulsion.
- 25

Example 11

Aftershave lotion

30	% by wt.
Lecithin	1.000
Polyglyceryl-10 stearate	6.000
Glycerol	5.000
Dicaprylyl ether	5.000
35 Preservative	q.s.
Water	ad
	100.000

The oil phase and the water phase are each heated separately to 70 - 75°C. The water phase is added dropwise to the oil phase, and a gel forms. The further dropwise addition of the water phase and cooling of the mixture produces an O/W microemulsion.

5

Example 12

Face-cleansing lotion

		% by wt.
10	Lecithin	2.000
	Decaglyceryl monolaurate	5.000
	Glycerol	5.000
	Dicaprylyl ether	5.000
	Preservative	q.s.
15	Water	ad
		100.000

20 The oil phase and the water phase are each heated separately to 70 - 75°C. The water phase is added dropwise to the oil phase, and a gel forms. The further dropwise addition of the water phase and cooling of the mixture produces an O/W microemulsion.

Example 13

25 Shower oil, low foaming

		% by wt.
	Lecithin	3.500
	PEG-20 glyceryl laurate	3.500
	Glycerol	5.000
30	Dicaprylyl ether	5.000
	Preservative	q.s.
	Water	ad
		100.000

35 The oil phase and the water phase are each heated separately to 70 - 75°C. The water phase is added dropwise to the oil phase, and a gel forms. The further dropwise addition of the water phase and cooling of the mixture produces an O/W microemulsion.

Example 14

	Pump atomizer	% by wt.
	Lecithin	3.000
5	PEG-20 monostearate	4.000
	Glycerol	5.000
	Dicaprylyl ether	5.000
	Preservative	q.s.
	Water	ad
10		100.000

The oil phase and the water phase are each heated separately to 70 - 75°C. The water phase is added dropwise to the oil phase, and a gel forms. The further dropwise addition of the water phase and cooling of the mixture produces an O/W microemulsion.

Example 15

Transparent cleansing emulsion for greasy skin

		% by wt.
20	Lecithin	3.000
	PEG-20 glyceryl stearate	4.000
	Glycerol	5.000
	Dicaprylyl ether	5.000
25	Preservative	q.s.
	Water	ad
		100.000

The oil phase and the water phase are each heated separately to 70 - 75°C. The water phase is added dropwise to the oil phase, and a gel forms. The further dropwise addition of the water phase and cooling of the mixture produces an O/W microemulsion.

Example 16

	Refreshing preshave lotion	% by wt.
35	Lecithin	4.000
	Ceteraeth-12	3.000
	Glycerol	5.000

Dicaprylyl ether	5.000
Preservative	q.s.
Water	ad
	100.000

5

The oil phase and the water phase are each heated separately to 70 - 75°C. The water phase is added dropwise to the oil phase, and a gel forms. The further dropwise addition of the water phase and cooling of the mixture produces an O/W microemulsion.

10

Example 17

Make-up removing lotion

	% by wt.
15 Lecithin	2.000
PEG-20 sorbitan isostearate	5.000
Glycerol	5.000
Octyldodecanol	5.000
Preservative	q.s.
20 Water	ad
	100.000

The oil phase and the water phase are each heated separately to 70 - 75°C. The water phase is added dropwise to the oil phase, and a gel forms. The further dropwise addition of the water phase and cooling of the mixture produces an O/W microemulsion.

25

Example 18

30 Base formulation for solubilizing perfume odorants (perfume atomizer)

	% by wt.
Lecithin	2.000
PEG-20 sorbitan isostearate	5.000
35 Glycerol	5.000
Cetearyl isononanoate	5.000
Preservative	q.s.
Water	ad
	100.000

The oil phase and the water phase are each heated separately to 70 - 75°C. The water phase is added dropwise to the oil phase, and a gel forms. The further dropwise addition of the water phase and cooling of the mixture produces an O/W microemulsion.

5

Example 19

Base formulation for treating the scalp

	% by wt.
Lecithin	2.000
10 PEG-20 sorbitan isostearate	5.000
Glycerol	5.000
Dioctylcyclohexane	5.000
Preservative	q.s.
Water	ad
15	100.000

The oil phase and the water phase are each heated separately to 70 - 75°C. The water phase is added dropwise to the oil phase, and a gel forms. The further dropwise addition of the water phase and cooling of the mixture produces an O/W microemulsion.

20

Example 20

	% by wt.
25 Lecithin	1.000
Polyglyceryl-10 stearate	6.000
Glycerol	5.000
Dioctylcyclohexane	5.000
Preservative	q.s.
30 Water	ad
	100.000

The oil phase and the water phase are each heated separately to 70 - 75°C. The water phase is added dropwise to the oil phase, and a gel forms. The further dropwise addition of the water phase and cooling of the mixture produces an O/W microemulsion.

35

Example 21

Deodorant/antiperspirant pump atomizer

		% by wt.
	Lecithin	1.000
5	PEG-20 sorbitan isostearate	2.500
	Glycerol	5.000
	Octyl dodecanol	2.500
	Aluminum chlorhydrate	5.000
	Preservative	q.s.
10	Water	ad
		100.000

- 15 The oil phase and the water phase are each heated separately to 70 - 75°C. The water phase is added dropwise to the oil phase, and a gel forms. The further dropwise addition of the water phase and cooling of the mixture produces an O/W microemulsion.

Example 22

		% by wt.
20	Lecithin	2.000
	Oleth-15	5.000
	Glycerol	5.000
	Caprylic/capric triglycerides	5.000
25	Preservative	q.s.
	Water	ad
		100.000

- 30 The oil phase and the water phase are each heated separately to 70 - 75°C. The water phase is added dropwise to the oil phase, and a gel forms. The further dropwise addition of the water phase and cooling of the mixture produces an O/W microemulsion.

Example 23

35		% by wt.
	Lecithin	3.000
	PEG-45 palm kernel oil glycerides	4.000
	Glycerol	5.000

Diethylcyclohexane	5.000
Preservative	q.s.
Water	ad
	100.000

5

The oil phase and the water phase are each heated separately to 70 - 75°C. The water phase is added dropwise to the oil phase, and a gel forms. The further dropwise addition of the water phase and cooling of the mixture produces an O/W microemulsion.

10

Example 24

	% by wt.
Lecithin	3.000
15 PEG-45 palm kernel oil glycerides	4.000
Glycerol	5.000
Cetearyl isononanoate	5.000
Preservative	q.s.
Water	ad
20	100.000

The oil phase and the water phase are each heated separately to 70 - 75°C. The water phase is added dropwise to the oil phase, and a gel forms. The further dropwise addition of the water phase and cooling of the mixture produces an O/W microemulsion.

25

Example 25

	% by wt.
30 Lecithin	2.000
PEG-20 sorbitan monooleate	5.000
Glycerol	5.000
Octyl dodecanol	5.000
Preservative	q.s.
35 Water	ad
	100.000

The oil phase and the water phase are each heated separately to 70 - 75°C. The water phase is added dropwise to the oil phase, and a gel

forms. The further dropwise addition of the water phase and cooling of the mixture produces an O/W microemulsion.

Example 26

5

	% by wt.
Lecithin	2.000
PEG-20 sorbitan monooleate	5.000
Glycerol	5.000
10 Caprylic/capric triglycerides	5.000
Preservative	q.s.
Water	ad
	100.000

- 15 The oil phase and the water phase are each heated separately to 70 - 75°C. The water phase is added dropwise to the oil phase, and a gel forms. The further dropwise addition of the water phase and cooling of the mixture produces an O/W microemulsion.

20 Example 27

	% by wt.
Lecithin	2.000
PEG-20 sorbitan monooleate	5.000
25 Glycerol	5.000
Cetearyl isononanoate	5.000
Preservative	q.s.
Water	ad
	100.000

30

The oil phase and the water phase are each heated separately to 70 - 75°C. The water phase is added dropwise to the oil phase, and a gel forms. The further dropwise addition of the water phase and cooling of the mixture produces an O/W microemulsion.

35

Example 28

Shower oil

	% by wt.
Lecithin	0.250

	Lauryl ether sulfate (25%)	40.000
	Glyceryl monolinoleate	0.250
	Glycerol	5.000
	Dicaprylyl ether	3.000
5	Sodium chloride	7.500
	Water	ad
		100.000

- 10 The oil phase and part of the water phase are each heated separately to 70 - 75°C. The water phase is added dropwise to the oil phase, and a gel forms. The further dropwise addition of the water phase and cooling of the mixture produces an O/W microemulsion.

Example 29

15

Face-cleansing gel

% by wt.

	Lecithin	6.660
20	PEG-50 hydrogenated castor oil isostearate	19.260
	Glycerol	18.520
	Dicaprylyl ether	18.520
	Water	37.040

- 25 The oil phase and the water phase are each heated separately to 70 - 75°C. The water phase is added dropwise to the oil phase, and a gel forms.

Example 30

30

Face-cleansing gel

% by wt.

	Lecithin	6.660
35	PEG-50 hydrogenated castor oil isostearate	19.260
	Glycerol	18.520
	Dicaprylyl ether	18.520
	Water	37.040

The oil phase and the water phase are each heated separately to 70 - 75°C. The water phase is added dropwise to the oil phase, and a gel forms.

5 Example 31

Eye make-up remover gel

	% by wt.
Lecithin	3.700
10 Polyglyceryl-10 stearate	22.200
Glycerol	18.500
Dioctylcyclohexane	18.500
Water	37.010

- 15 The oil phase and the water phase are each heated separately to 70 - 75°C. The water phase is added dropwise to the oil phase, and a gel forms.

20 Example 32

Hair gel

	% by wt.
Lecithin	11.100
PEG-20 sorbitan isostearate	14.800
25 Glycerol	18.500
Dicaprylyl ether	18.500
Water	37.100

- 30 The oil phase and the water phase are each heated separately to 70 - 75°C. The water phase is added dropwise to the oil phase, and a gel forms.

35 Example 33

Shower gel

	% by wt.
Lecithin	0.870
Lauryl ether sulfate (25%)	69.600
Glycerol	8.600
Dicaprylyl ether	8.700

Sodium chloride

12.230

5 The oil phase and the water phase are each heated separately to 70 - 75°C. The water phase is added dropwise to the oil phase, and a gel forms.

Example 34

Gel

		% by wt.
10	Lecithin	2.000
	Polyclycerol-10 stearate	24.000
	Glycerol isostearate	2.000
	Glycerol	20.000
	Diethylcyclohexane	20.000
15	Water	32.000

Patent claims:

1. A gel or low-viscosity transparent or translucent microemulsion of the oil-in-water type, comprising a water phase and an oil phase, which are essentially composed of low-volatility constituents, comprising: at least one phospholipid and at least one oil-in-water emulsifier and optionally at least one W/O emulsifier, obtainable by adding the water phase with its constituents to the oil phase with its constituents, in particular the phospholipid and the O/W emulsifier and optionally W/O emulsifier, the phases being mixed with one another and a gel state being achieved, and if a low-viscosity O/W microemulsion is desired, further parts of the water phase are added and the phases are mixed, it being possible, if desired, for the phases to comprise further auxiliaries, additives and/or active ingredients.
2. A process for the preparation of gels or low-viscosity transparent or translucent microemulsions of the oil-in-water type, comprising a water phase and an oil phase, which is essentially composed of low-volatility constituents, comprising at least one phospholipid and at least one oil-in-water emulsifier and optionally at least one W/O emulsifier, characterized in that a phospholipid is dissolved in the oil phase, optionally with further constituents, and the water phase, optionally with further constituents, is added thereto and the phases are mixed, during which the viscosity increases and, for example, the gels are obtained and, upon the further addition of the water phase, the microemulsions arise, where the oil-in-water emulsifier and optionally the W/O emulsifier can be added to the oil phase or can be added at the gel formation stage or else following preparation of the gels.
3. The gel as claimed in claim 1 or 2, characterized in that it is used as hair gel, shower gel, or skin gel.
4. The gel or microemulsion as claimed in claim 1 or 2, characterized in that it comprises deodorants or antiperspirants.
5. The gel or microemulsion as claimed in claim 1 or 2, characterized in that it comprises a UVA and/or UVB filter substance.

6. The gel or microemulsion as claimed in claim 1 or 2, characterized in that it comprises antioxidants.
- 5 7. The gel or microemulsion as claimed in claim 1 or 2, characterized in that it is used as a cosmetic cleansing preparation.
8. The gel or microemulsion as claimed in claim 1 or 2, characterized in that it is used for haircare.
- 10 9. The gel or microemulsion as claimed in claim 1 or 2, characterized in that it comprises active ingredients, additives or auxiliaries.

VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM
GEBIET DES PATENTWESENS

PCT

REC'D 21 MAR 2001

WIPO

PCT

INTERNATIONALER VORLÄUFIGER PRÜFUNGSBERICHT

(Artikel 36 und Regel 70 PCT)

74



Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts 6713Ltk98/158	WEITERES VORGEHEN siehe Mitteilung über die Übersendung des internationalen vorläufigen Prüfungsberichts (Formblatt PCT/IPEA/416)	
Internationales Aktenzeichen PCT/EP99/10241	Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) 21/12/1999	Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr) 22/12/1998
Internationale Patentklassifikation (IPK) oder nationale Klassifikation und IPK A61K7/50		
Anmelder BEIERSDORF AG et al.		

1. Dieser internationale vorläufige Prüfungsbericht wurde von der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde erstellt und wird dem Anmelder gemäß Artikel 36 übermittelt.
2. Dieser BERICHT umfaßt insgesamt 6 Blätter einschließlich dieses Deckblatts.
☐ Außerdem liegen dem Bericht ANLAGEN bei; dabei handelt es sich um Blätter mit Beschreibungen, Ansprüchen und/oder Zeichnungen, die geändert wurden und diesem Bericht zugrunde liegen, und/oder Blätter mit vor dieser Behörde vorgenommenen Berichtigungen (siehe Regel 70.16 und Abschnitt 607 der Verwaltungsrichtlinien zum PCT).

Diese Anlagen umfassen insgesamt Blätter.

3. Dieser Bericht enthält Angaben zu folgenden Punkten:

- I ☒ Grundlage des Berichts
- II ☐ Priorität
- III ☐ Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit
- IV ☐ Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung
- V ☒ Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung
- VI ☐ Bestimmte angeführte Unterlagen
- VII ☒ Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung
- VIII ☐ Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung

Datum der Einreichung des Antrags 23/06/2000	Datum der Fertigstellung dieses Berichts 19.03.2001
Name und Postanschrift der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde:  Europäisches Patentamt D-80298 München Tel. +49 89 2399 - 0 Tx: 523656 epmu d Fax: +49 89 2399 - 4465	Bevollmächtigter Bediensteter Borst, M Tel. Nr. +49 89 2399 8648 

I. Grundlage des Berichts

1. Dieser Bericht wurde erstellt auf der Grundlage (*Ersatzblätter, die dem Anmeldeamt auf eine Aufforderung nach Artikel 14 hin vorgelegt wurden, gelten im Rahmen dieses Berichts als "ursprünglich eingereicht" und sind ihm nicht beigelegt, weil sie keine Änderungen enthalten.*):

Beschreibung, Seiten:

1-61 ursprüngliche Fassung

Patentansprüche, Nr.:

1-9 ursprüngliche Fassung

2. Hinsichtlich der **Sprache**: Alle vorstehend genannten Bestandteile standen der Behörde in der Sprache, in der die internationale Anmeldung eingereicht worden ist, zur Verfügung oder wurden in dieser eingereicht, sofern unter diesem Punkt nichts anderes angegeben ist.

Die Bestandteile standen der Behörde in der Sprache: zur Verfügung bzw. wurden in dieser Sprache eingereicht; dabei handelt es sich um

- ☐ die Sprache der Übersetzung, die für die Zwecke der internationalen Recherche eingereicht worden ist (nach Regel 23.1(b)).
- ☐ die Veröffentlichungssprache der internationalen Anmeldung (nach Regel 48.3(b)).
- ☐ die Sprache der Übersetzung, die für die Zwecke der internationalen vorläufigen Prüfung eingereicht worden ist (nach Regel 55.2 und/oder 55.3).

3. Hinsichtlich der in der internationalen Anmeldung offenbarten **Nucleotid- und/oder Aminosäuresequenz** ist die internationale vorläufige Prüfung auf der Grundlage des Sequenzprotokolls durchgeführt worden, das:

- ☐ in der internationalen Anmeldung in schriftlicher Form enthalten ist.
- ☐ zusammen mit der internationalen Anmeldung in computerlesbarer Form eingereicht worden ist.
- ☐ bei der Behörde nachträglich in schriftlicher Form eingereicht worden ist.
- ☐ bei der Behörde nachträglich in computerlesbarer Form eingereicht worden ist.
- ☐ Die Erklärung, daß das nachträglich eingereichte schriftliche Sequenzprotokoll nicht über den Offenbarungsgehalt der internationalen Anmeldung im Anmeldezeitpunkt hinausgeht, wurde vorgelegt.
- ☐ Die Erklärung, daß die in computerlesbarer Form erfassten Informationen dem schriftlichen Sequenzprotokoll entsprechen, wurde vorgelegt.

4. Aufgrund der Änderungen sind folgende Unterlagen fortgefallen:

- ☐ Beschreibung, Seiten:
- ☐ Ansprüche, Nr.:
- ☐ Zeichnungen, Blatt:

5. ☐ Dieser Bericht ist ohne Berücksichtigung (von einigen) der Änderungen erstellt worden, da diese aus den angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde über den Offenbarungsgehalt in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgehen (Regel 70.2(c)).

(Auf Ersatzblätter, die solche Änderungen enthalten, ist unter Punkt 1 hinzuweisen; sie sind diesem Bericht beizufügen).

6. Etwaige zusätzliche Bemerkungen:

V. Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung

1. Feststellung

Neuheit (N)	Ja: Ansprüche	3-8
	Nein: Ansprüche	1, 2, 9
Erfinderische Tätigkeit (ET)	Ja: Ansprüche	
	Nein: Ansprüche	1-9
Gewerbliche Anwendbarkeit (GA)	Ja: Ansprüche	1-9
	Nein: Ansprüche	

2. Unterlagen und Erklärungen
siehe Beiblatt

VII. Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung

Es wurde festgestellt, daß die internationale Anmeldung nach Form oder Inhalt folgende Mängel aufweist:
siehe Beiblatt

Abschnitt V

Teil 2

Als wesentlich angesehene Unterlagen (D)

- D1: WO 92 18147 A (AFFINITY BIOTECH INC) 29. Oktober 1992 (1992-10-29)
D2: WO 97 30695 A (LDS TECHNOLOGIES INC ;YIV SEANG H (US); TUSTIAN ALEX K (US)) 28. August 1997 (1997-08-28) in der Anmeldung erwähnt
D3: EP-A-0 760 237 (CIPLA LIMITED) 5. März 1997 (1997-03-05) in der Anmeldung erwähnt
D4: US-A-4 567 161 (POSANSKI ULRICH ET AL) 28. Januar 1986 (1986-01-28)
D5: GENNARO A R "Remington: The Science and Practice of Pharmacy", 19. ed., 1995, Seiten 1512-1513, Mack Publishing Company, Easton, Pennsylvania 18042
D6: GERHARTZ W et al., 'Ullmann's Encyclopedia of industrial chemistry', Volume A9, Seiten 302, 5. ed. 1989, VCH Verlagsgesellschaft, Weinheim
D7: WO 97 09964 A (ASTRA AB ;VON CORSWANT CHRISTIAN (SE)) 20. März 1997 (1997-03-20)

Die Numerierung wird im weiteren Verfahren beibehalten.

Eine Kopie von D5 und D6, welche im Internationalen Recherchenbericht nicht genannt waren, liegt bei.

1. Neuheit (Artikel 33(2) PCT)

1.1. D1 ist neuheitsschädlich für die Ansprüche 1, 2 und 9.

D1 befaßt sich mit Wasser-in-Öl-Mikroemulsionen, welche durch Zugabe von Wasser in Öl-in-Wasser-Mikroemulsion überführbar sind.

Entsprechend D1 werden Wasser-in-Öl-Mikroemulsionen durch Zugabe der Wasserphase zu der Mischung aus Ölphase und Emulgator hergestellt (D1: Seite 29, Zeile 22-31). Besagte Wasser-in-Öl-Mikroemulsionen schließen Beispiele ein, welche Lecithin enthalten und durch Zugabe von Wasser in Öl-in-Wasser-Mikroemulsionen überführt werden (D1: Seite 32, Beispiel 2, 4). Dabei erfolgt offensichtlich eine Phasenumkehr, welche bekanntermaßen über einen intermediären viskoelastischen gelartigen Übergangszustand verläuft (vgl. D5: Seite 1512, rechte Spalte).

D1 nimmt nicht nur die in vorliegendem Anspruch 1 definierten Mikroemulsionen

vom Typ Öl-in-Wasser vorweg (vgl. Punkt (i) oben), sondern auch die dort definierten Gele.

Entsprechend D1 können die Wasser-in-Öl-Mikroemulsionen Gele sein (D1: Seite 8, Zeile 24-26 und Seite 37, Zeile 9-11). Ein derartiges Gel stellt offenbar die halbfeste Formulierung C dar, welche aus der Wasser-in-Öl-Mikroemulsion entsprechend Beispiel 4 durch Zugabe von Kokosfett hervorgeht (D1: Seite 37, Zeile 33 - Seite 38, Zeile 14). Im Unterschied zu der im vorliegenden Anspruch 1 dargestellten Herstellungsweise wird das Gel entsprechend D1 durch nachträgliche Zugabe eines weiteren Teiles der Ölphase gewonnen. Derzeit ist nicht ersichtlich, daß diese vom vorliegenden Anspruch 1 abweichende Reihenfolge der Zugabe der einzelnen Komponenten die Produkteigenschaften des resultierenden Gels beeinflußt, zumal der vorliegende Anspruch 1 - im Gegensatz zum vorliegenden Anspruch 2 - nicht definiert, daß die Wasserphase erst nach Auflösen des Phospholipids und der weiteren Bestandteile in der Ölphase zugegeben wird. Ferner definiert der vorliegende Anspruch 1 - im Gegensatz zum vorliegenden Anspruch 2 - nicht das Zustandekommen des Gels als einen durch das Zumischen von Wasserphase hervorgerufenen Viskositätsanstieg, welcher ein wesentliches Merkmal zu sein scheint (vgl. auch vorliegende Beschreibung: Seite 20, Zeilen 3-5).

1.2. D2 ist neuheitsschädlich für die Ansprüche 1, 2 und 9.

D2 beschreibt Wirkstoffpräkonzentrate bestehend aus einer Ölphase, welche ein Phospholipid (Centrohase® 31) und einen O/W-Emulgator umfaßt. Entsprechend D2 bildet besagtes Präkonzentrat, wenn mit Wasser verdünnt, eine Öl-in-Wasser-Mikroemulsion (D2: Seite 14, Beispiel 1). Verdünnung mit Wasser entspricht einer Zugabe von Wasser zur Ölphase und bedingt eine Phasenumkehr von der kontinuierlichen Ölphase des Präkonzentrats zu einer kontinuierlichen Wasserphase der Öl-in-Wasser-Mikroemulsion. Eine derartige Phasenumkehr verläuft in der Regel über einen viskoelastischen gelartigen Übergangszustand (vgl. D5: Seite 1512, rechte Spalte). Folglich ist ein Gelzustand implizit in D2 beschrieben.

1.3. Eine analoge Argumentation wie unter Punkt 1.2. gilt auch für die Dokumente D3 (Seite 4-6, Beispiele 1-4) und D4 (Spalte 3-4, Beispiel 1).

1.4. D8 ist neuheitsschädlich für die Ansprüche 1 und 9.

D8 beschreibt bikontinuierliche Mikroemulsionen enthaltend Lecithin als hydrophoben Emulgator neben einem hydrophilen Emulgator (D8: Seite 6, Zeilen

1-14). Entsprechend D8 können bikontinuierliche Mikroemulsionen durch Verschiebung des Mengenverhältnisses zwischen polarer und nicht-polarer Phase hergestellt werden. Der bei Phasenumkehr von Emulsionen zu beobachtende viskoelastische gelartigen Übergangszustand (vgl. D5: Seite 1512, rechte Spalte) liegt offenbar im Fall einer bikontinuierlichen Mikroemulsion vor. Gegenwärtig ist nicht ersichtlich, daß die Zugabe von Wasserphase zur Ölphase, wie in Anspruch 1 definiert, einen Einfluß auf das resultierende bikontinuierliche Mikroemulsionsgel haben könnte.

2. Erfinderische Tätigkeit (Artikel 33(3) PCT)

- 2.1. Mangels Neuheit kann der Gegenstand der Ansprüche 1, 2 und 9 nicht als auf einer erfinderischen Tätigkeit beruhend erachtet werden.
- 2.2. Auch die zusätzlichen, in den abhängigen Ansprüchen 3-8 offenbarten Merkmale scheinen nicht geeignet, eine erfinderische Tätigkeit zu begründen, da besagte zusätzliche Merkmale triviale Modifikationen ohne technischen Effekt darstellen.

Abschnitt VII

Im Gegensatz zu den Erfordernissen von Regel 5.1(a)(ii) PCT sind der nächstliegende Stand der Technik (D1) und sein einschlägiger Inhalt nicht in der Beschreibung angegeben.

VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

PCT

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

(Artikel 18 sowie Regeln 43 und 44 PCT)

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts 6713Ltk98	WEITERES VORGEHEN	siehe Mitteilung über die Übermittlung des internationalen Recherchenberichts (Formblatt PCT/ISA/220) sowie, soweit zutreffend, nachstehender Punkt 5
Internationales Aktenzeichen PCT/EP 99/ 10241	Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) 21/12/1999	(Frühestes) Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr) 22/12/1998
Anmelder BEIERSDORF AG et al.		

Dieser internationale Recherchenbericht wurde von der Internationalen Recherchenbehörde erstellt und wird dem Anmelder gemäß Artikel 18 übermittelt. Eine Kopie wird dem Internationalen Büro übermittelt.

Dieser internationale Recherchenbericht umfaßt insgesamt 3 Blätter.

☒ Darüber hinaus liegt ihm jeweils eine Kopie der in diesem Bericht genannten Unterlagen zum Stand der Technik bei.

1. Grundlage des Berichts

a. Hinsichtlich der **Sprache** ist die internationale Recherche auf der Grundlage der internationalen Anmeldung in der Sprache durchgeführt worden, in der sie eingereicht wurde, sofern unter diesem Punkt nichts anderes angegeben ist.

☐ Die internationale Recherche ist auf der Grundlage einer bei der Behörde eingereichten Übersetzung der internationalen Anmeldung (Regel 23.1 b)) durchgeführt worden.

b. Hinsichtlich der in der internationalen Anmeldung offenbarten **Nucleotid- und/oder Aminosäuresequenz** ist die internationale Recherche auf der Grundlage des Sequenzprotokolls durchgeführt worden, das

☐ in der internationalen Anmeldung in Schriftlicher Form enthalten ist.

☐ zusammen mit der internationalen Anmeldung in computerlesbarer Form eingereicht worden ist.

☐ bei der Behörde nachträglich in schriftlicher Form eingereicht worden ist.

☐ bei der Behörde nachträglich in computerlesbarer Form eingereicht worden ist.

☐ Die Erklärung, daß das nachträglich eingereichte schriftliche Sequenzprotokoll nicht über den Offenbarungsgehalt der internationalen Anmeldung im Anmeldezeitpunkt hinausgeht, wurde vorgelegt.

☐ Die Erklärung, daß die in computerlesbarer Form erfaßten Informationen dem schriftlichen Sequenzprotokoll entsprechen, wurde vorgelegt.

2. ☐ Bestimmte Ansprüche haben sich als nicht recherchierbar erwiesen (siehe Feld I).

3. ☐ Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung (siehe Feld II).

4. Hinsichtlich der Bezeichnung der Erfindung

☒ wird der vom Anmelder eingereichte Wortlaut genehmigt.

☐ wurde der Wortlaut von der Behörde wie folgt festgesetzt:

5. Hinsichtlich der Zusammenfassung

☒ wird der vom Anmelder eingereichte Wortlaut genehmigt.

☐ wurde der Wortlaut nach Regel 38.2b) in der in Feld III angegebenen Fassung von der Behörde festgesetzt. Der Anmelder kann der Behörde innerhalb eines Monats nach dem Datum der Absendung dieses internationalen Recherchenberichts eine Stellungnahme vorlegen.

6. Folgende Abbildung der Zeichnungen ist mit der Zusammenfassung zu veröffentlichen: Abb. Nr. _____

☐ wie vom Anmelder vorgeschlagen

☐ weil der Anmelder selbst keine Abbildung vorgeschlagen hat.

☐ weil diese Abbildung die Erfindung besser kennzeichnet.

☒ keine der Abb.

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES
 IPK 7 A61K7/50 A61K9/107

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)
 IPK 7 A61K

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	WO 92 18147 A (AFFINITY BIOTECH INC) 29. Oktober 1992 (1992-10-29) Seite 8, Zeile 24 -Seite 8, Zeile 26 Seite 12, Zeile 35 -Seite 12, Zeile 36 Seite 29, Zeile 22 -Seite 29, Zeile 31 Seite 32; Beispiele 2,4 Seite 37, Zeile 33 -Seite 38, Zeile 14 ---	1,2,9
X	WO 97 30695 A (LDS TECHNOLOGIES INC ;YIV SEANG H (US); TUSTIAN ALEX K (US)) 28. August 1997 (1997-08-28) in der Anmeldung erwähnt Seite 14; Beispiel 1 ---	1,2,9
X	EP 0 760 237 A (CIPLA LIMITED) 5. März 1997 (1997-03-05) in der Anmeldung erwähnt Seite 4 -Seite 6; Beispiele 1-4 ---	1,2,9
-/-		

☒ Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen

☒ Siehe Anhang Patentfamilie

* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :

"A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist

"E" älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist

"L" Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)

"O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht

"P" Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

"T" Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

"X" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden

"Y" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

"&" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

20. April 2000

Absenddatum des internationalen Recherchenberichts

22/05/2000

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde
 Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentaan 2
 NL - 2280 HV Rijswijk
 Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
 Fax: (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Borst, M

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	US 4 567 161 A (POSANSKI ULRICH ET AL) 28. Januar 1986 (1986-01-28) Spalte 3 -Spalte 4; Beispiel 1 ----	1,2,9
X	WO 97 09964 A (ASTRA AB ;VON CORSWANT CHRISTIAN (SE)) 20. März 1997 (1997-03-20) Seite 4, Zeile 9 -Seite 4, Zeile 22 Seite 6, Zeile 1 -Seite 6, Zeile 14 -----	1,9

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

EP 99/10241

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 9218147	A	29-10-1992	AT 183099 T	15-08-1999
			AU 668509 B	09-05-1996
			AU 1896692 A	17-11-1992
			CA 2108266 A	20-10-1992
			CN 1066183 A	18-11-1992
			DE 69229779 D	16-09-1999
			DE 69229779 T	23-12-1999
			EP 0580778 A	02-02-1994
			IL 101613 A	22-02-1998
			JP 6507172 T	11-08-1994
			MX 9201816 A	30-10-1992
			PT 100400 A, B	31-08-1993
			US 5688761 A	18-11-1997
			US 5646109 A	08-07-1997
			US 5633226 A	27-05-1997
			US 5444041 A	22-08-1995
WO 9730695	A	28-08-1997	AU 2272097 A	10-09-1997
EP 0760237	A	05-03-1997	AU 706995 B	01-07-1999
			AU 6216296 A	06-03-1997
			US 5929030 A	27-07-1999
US 4567161	A	28-01-1986	DE 3225706 A	12-01-1984
			AT 21607 T	15-09-1986
			DE 3365656 D	02-10-1986
			EP 0100448 A	15-02-1984
			JP 59022651 A	04-02-1984
			ZA 8304998 A	25-04-1984
WO 9709964	A	20-03-1997	AU 702366 B	18-02-1999
			AU 7003796 A	01-04-1997
			BR 9610089 A	05-01-1999
			CA 2230730 A	20-03-1997
			CN 1201386 A	09-12-1998
			CZ 9800643 A	12-08-1998
			EP 0850046 A	01-07-1998
			HU 9901215 A	30-08-1999
			JP 11512424 T	26-10-1999
			NO 981021 A	09-03-1998
			NZ 318530 A	29-09-1999
			PL 325825 A	03-08-1998
			SK 28398 A	04-11-1998

Translation
09/890078

PATENT COOPERATION TREATY

PCT

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

(PCT Article 36 and Rule 70)

3

RECEIVED

OCT 17 2001

TECH CENTER 1600/2900

Applicant's or agent's file reference 6713Ltk98/158	FOR FURTHER ACTION See Notification of Transmittal of International Preliminary Examination Report (Form PCT/IPEA/416)	
International application No. PCT/EP99/10241	International filing date (day/month/year) 21 December 1999 (21.12.99)	Priority date (day/month/year) 22 December 1998 (22.12.98)
International Patent Classification (IPC) or national classification and IPC A61K 7/50		
Applicant BEIERSDORF AG		

1. This international preliminary examination report has been prepared by this International Preliminary Examining Authority and is transmitted to the applicant according to Article 36.
2. This REPORT consists of a total of <u>6</u> sheets, including this cover sheet. <input type="checkbox"/> This report is also accompanied by ANNEXES, i.e., sheets of the description, claims and/or drawings which have been amended and are the basis for this report and/or sheets containing rectifications made before this Authority (see Rule 70.16 and Section 607 of the Administrative Instructions under the PCT). These annexes consist of a total of _____ sheets.
3. This report contains indications relating to the following items: I <input checked="" type="checkbox"/> Basis of the report II <input type="checkbox"/> Priority III <input type="checkbox"/> Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability IV <input type="checkbox"/> Lack of unity of invention V <input checked="" type="checkbox"/> Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement VI <input type="checkbox"/> Certain documents cited VII <input checked="" type="checkbox"/> Certain defects in the international application VIII <input type="checkbox"/> Certain observations on the international application

Date of submission of the demand 23 June 2000 (23.06.00)	Date of completion of this report 19 March 2001 (19.03.2001)
Name and mailing address of the IPEA/EP	Authorized officer
Facsimile No.	Telephone No.

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.

PCT/EP99/10241

I. Basis of the report

1. This report has been drawn on the basis of (*Replacement sheets which have been furnished to the receiving Office in response to an invitation under Article 14 are referred to in this report as "originally filed" and are not annexed to the report since they do not contain amendments.*):

- ☐ the international application as originally filed.
- ☒ the description, pages 1-61, as originally filed,
 pages _____, filed with the demand,
 pages _____, filed with the letter of _____,
 pages _____, filed with the letter of _____.
- ☒ the claims, Nos. 1-9, as originally filed,
 Nos. _____, as amended under Article 19,
 Nos. _____, filed with the demand,
 Nos. _____, filed with the letter of _____,
 Nos. _____, filed with the letter of _____.
- ☐ the drawings, sheets/fig _____, as originally filed,
 sheets/fig _____, filed with the demand,
 sheets/fig _____, filed with the letter of _____,
 sheets/fig _____, filed with the letter of _____.

2. The amendments have resulted in the cancellation of:

- ☐ the description, pages _____
- ☐ the claims, Nos. _____
- ☐ the drawings, sheets/fig _____

3. ☐ This report has been established as if (some of) the amendments had not been made, since they have been considered to go beyond the disclosure as filed, as indicated in the Supplemental Box (Rule 70.2(c)).

4. Additional observations, if necessary:

V. Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement**1. Statement**

Novelty (N)	Claims	3-8	YES
	Claims	1, 2, 9	NO
Inventive step (IS)	Claims		YES
	Claims	1-9	NO
Industrial applicability (IA)	Claims	1-9	YES
	Claims		NO

2. Citations and explanations**Documents (D) considered to be essential**

- D1 WO-A-92 18147 (AFFINITY BIOTECH INC) 29 October 1992 (1992-10-29)
- D2 WO-A-97 30695 (LDS TECHNOLOGIES INC; YIV SEANG H (US); TUSTIAN ALEX K (US)) 28 August 1997 (1997-08-28) cited in the application
- D3 EP-A-0 760 237 (CIPLA LIMITED) 5 March 1997 (1997-03-05) cited in the application
- D4 US-A-4 567 161 (POSANSKI ULRICH ET AL) 28 January 1986 (1986-01-28)
- D5 GENNARO A R "Remington: The Science and Practice of Pharmacy", 19th edition 1995, pages 1512-1513, Mack Publishing Company, Easton, Pennsylvania 18042
- D6 GERHARTZ W et al., "Ullmann's Encyclopedia of industrial chemistry", Volume A9, pages 302, 5th edition 1989, VCH publishing house, Weinheim
- D7 WO-A-97 09964 (ASTRA AB; VON CORSWANT CHRISTIAN (SE)) 20 March 1997 (1997-03-20)

The numbering will be retained throughout the proceedings. Copies of D5 and D6, which were not international search report citations, are enclosed.

1. Novelty (PCT Article 33(2))

- 1.1 D1 is prejudicial to novelty for Claims 1, 2 and 9.

D1 relates to water-in-oil microemulsions that can be converted into oil-in-water microemulsions by adding water.

As described in D1, adding the water phase to the mixture of the oil phase and the emulsifier produces water-in-oil microemulsions (D1: page 29, lines 22-31). Said water-in-oil microemulsions include examples that contain lecithin and are converted by adding water to oil-in-water microemulsions (D1: page 32, Examples 2, 4). Then a phase reaction clearly occurs and, as is known, passes by way of an intermediary viscoelastic gel-like transition state (cf. D5: page 1512, right-hand column).

D1 does not only anticipate the microemulsions defined in present Claim 1 of the oil-in-water type (cf. item (i) above) but also the gels defined therein.

As described in D1, the water-in-oil microemulsions can be gels (D1: page 8, lines 24-26 and page 37, lines 9-11). Such a gel clearly represents the semi-solid formulation C, which follows from the water-in-oil microemulsion as described in Example 4 by adding coconut oil (D1: page 37, page 33 to page 38, line 14). As compared with the manner of production shown in present Claim 1, the gel described in D1 is obtained by adding a further part of the oil phase later. It is not clear to date whether this order of adding the individual constituents, which order differs from present Claim 1, affects the product properties of the resulting gel, especially since present Claim 1 - as compared with present Claim 2 - does not specify that the water phase is only added when the phospholipids and the other constituents are dissolved in the oil phase. Moreover, present Claim 1 does not define - as compared with present

Claim 2 - the completion of the gel as an increase in viscosity caused by mixing the water phase; this increase seems to be an essential feature (cf. also present description: page 20, lines 3-5).

- 1.2 D2 is prejudicial to novelty for Claims 1, 2 and 9. D2 describes active ingredient concentrates consisting of an oil phase, comprising a phospholipid (centrobase®31) and an oil-in-water emulsifier. According to D2 said preconcentrate forms an oil-in-water microemulsion (D2: page 14, example 1) when diluted with water. Dilution with water corresponds to addition of water to the oil phase and necessitates phase reaction from the continuous oil phase of the preconcentrate to form a continuous water phase of the oil-in-water microemulsion. Such a phase reaction generally goes through a viscoelastic gel-like transition state (cf. D5: page 1512, right-hand column). Consequently, a gel state is described implicitly in D2.
- 1.3 Similar arguments like those set out in item 1.2 also apply to D3 (pages 4-6, Examples 1-4) and D4 (columns 3-4, Example 1).
- 1.4 D8 is prejudicial to novelty for Claims 1 and 9. D8 describes bicontinuous microemulsions containing lecithin as a hydrophobic emulsifier in addition to a hydrophilic emulsifier (D8: page 6, lines 1-14). According to D8, bicontinuous microemulsions can be produced by displacing the proportion of ingredients between the polar and the non-polar phase. The viscoelastic gel-like transition state to be observed during phase reaction of emulsions (cf. D5:

page 1512, right-hand column) clearly occurs in the case of a bicontinuous microemulsion. Currently, it is not clear that adding the water phase to the oil phase, as defined in Claim 1, might have an influence on the resulting bicontinuous microemulsion gel.

2. Inventive step (PCT Article 33(3))

- 2.1 Due to a lack of novelty the subject matter of Claims 1, 2 and 9 cannot be considered to involve an inventive step.
- 2.2 The additional features disclosed in dependent Claims 3 to 8 do not seem to be suitable for justifying an inventive step, since said additional features represent trivial modifications without a technical effect.

VII. Certain defects in the international application

The following defects in the form or contents of the international application have been noted:

Contrary to PCT Rule 5.1(a)(ii), the description does not cite D1 or indicate the relevant prior art disclosed therein.